

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 10-007658

(43)Date of publication of application : 13.01.1998

(51)Int.Cl.

C07D231/40
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/44
 C07D231/38
 C07D401/04
 C07D405/04
 C07D409/04

(21)Application number : 09-056883

(71)Applicant : SUMITOMO PHARMACEUT CO LTD

(22)Date of filing : 24.02.1997

(72)Inventor : MATSUSHITA YOSHIYO
 HASEGAWA HIROHIKO
 KURIBAYASHI YOSHIKAZU
 OHASHI NAOHITO

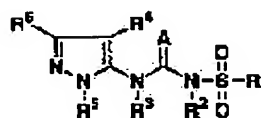
(30)Priority

Priority number : 08 65498 Priority date : 26.02.1996 Priority country : JP

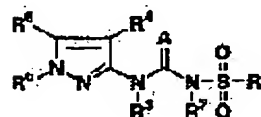
(54) DERIVATIVE OF SULFONYL UREIDOPYRAZOLE

(57)Abstract:

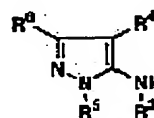
PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain the new subject compound having inhibiting action for an endoserine transforming enzyme and useful for curing agents and therapeutic agents for various diseases such as circular diseases, trachea contraction, etc., caused by endoserine. SOLUTION: This derivative of sulfonyl ureidopyrazole is a compound expressed by formula I or II (A is O or S; R¹ is an alkyl, alkenyl, aryl, etc.; R² and R³ are each H, an alkyl, an alkenyl, an aryl, a heteroarylalkyl, etc.; R⁴ and R⁶ are each H, a halogen, cyano, nitro, alkyl, etc.; R⁵ is H, an alkyl, an alkenyl, an alkynyl, a heterocyclic group, etc.) or its pharmaceutically allowable acid added salt or an alkali added salt and e.g. 4-cyano-1-phenyl-5-[(3-benzenesulfonyl)-ureide]-(1H)-pyrazole, etc., are cited. The compound of formula I is obtained by reacting a reaction product of a compound of formula III with a compound of formula IV with a compound of the formula R²'-W (R²' is the same] with R² but except H; W is a releasing group).



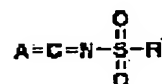
I



II



III



IV

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

特開平10-7658

(43)公開日 平成10年(1998)1月13日

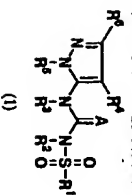
(51)IntCl ⁴	識別記号	片内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 23/40			C 0 7 D 23/40	
A 6 1 K 31/415	ABA		A 6 1 K 31/415	ABA
	ABN			ABN
	ABU			ABU
	ABX			ABX
		審査請求	未請求	請求項の数19 F D (全180頁)
				最終頁に続く

(21) 出願番号	特願P9-56883
(22) 出願日	平成9年(1997)2月24日
(23) 優先権主張番号	特願P8-65498
(22) 優先日	平8(1996)2月26日
(23) 優先権主張国	日本(JP)
(71) 出願人	000183370 住友製煉株式会社 大阪府大阪市中央区道徳町2丁目2番8号
(72) 発明者	松下 雄代 大阪市此花区春日出中3丁目1番8号 住
(72) 発明者	友成製煉式会社内 長谷川 浩彦 大阪市此花区春日出中3丁目1番88号 住
(72) 発明者	友成製煉式会社内 栗林 健和 大阪市此花区春日出中3丁目1番88号 住
(74) 代理人	友成製煉式会社内 弁理士 中村 敏夫

最終頁に続<

(54) 【発明の名称】 スルホニルウレイドビゾール誘導体

表し、 R_6 は水素原子、ハロゲン原子等を表す。]

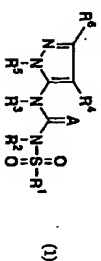


〔式中、 R_1 は酸素原子または硫黄原子を表し、 R_1^1 はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シロアルキル基等を表し、 R_2^1 および R^3 はそれぞれ同一または異なる4個いてもよく、水素原子、アルキル基等を表し、 R_1^2 はアロゲン原子、アルデヒド基、カルボニル基、シロアルキル基等を表し、 R^5 は、アルケニル基、アルキニル基、シロアルキル基、シロアルキル基等を表し、

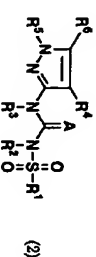
【待許請求の範囲】

【請求項1】 一般式（1）もしくは（2）

【化1】



【作 2】

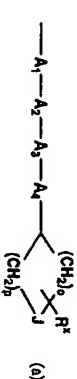


〔式中、Aは酸素原子または硫黄原子を要す。R¹はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル



もしくは式 (b)

【化4】



【153】

ルビニル基、ヘテロ環基、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-N$
 (R^1) 、置換アルキル基、置換アルケニル基、置
 換アリール基、置換シクロアルキル基、置換シクロア
 ルケニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロア
 ルケニル基、置換アリール基、置換アル
 キル基、置換ヘテロアリール基、または置換ヘ
 テロ環基を表すか、または式 (a)

を要す。R2 および R3 はそれぞれ同一または異なるアミノ酸残基である。R4 および R5 はそれぞれ同一または異なるアミノ酸残基である。または前記式 (a) または (b) を要する。

ルキニル基、 $-CO-R^{12}$ 、 $-CS-R^{12}$ 、 $-CO_2$
 R^{12} 、 $-CO-S-R^{12}$ 、 $-CS_2-R^{12}$ 、 $-CS-O$
 $-R^{12}$ 、 $-CON(R^{12})R^{13}$ 、 $-CSN(R^{12})$
 $-S(O)I-R^{12}$ 、もしくは $-SO_2-N(R^{12})$
 R^{12} 、 R^{13} 、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アル
 キルニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケ
 ニル基、置換シクロアルキルアルキル基、置換シクロアラ
 ルニルアルキル基、置換アリール基、置換ベンジルアル
 キル基、置換ヘテロ環基、もしくは置換ヘテロアルキルアル
 キル基を表すか、または前記式 (a) もしくは (b) を
 表す、前記及び後記の定義もしくはは式において、

アルケニル基、置換シクロアルキルキル基、置換エタ
ノールアルケニルアルキル基、置換アリアル基、置換アラ
キル基、置換ヘテロアリアルアルキル基、もしくは置換
ヘテロ環基を表すか、または前記式 (a) もしくは (b)
を表す。R⁵は、水素原子、アルキル基、アルケ
ニル基、アリール基、シクロアルキル基、シクロアル
ケニル基、アリーニル基、ヘテロ環基、ヘテロアリアル

(2) A_1, A_2, A_3 および A_4 は同一または異なる 2 各々の環結合もしくは、 $-CH_2-$ を置き、または環より合二つが一線になって $-CH=CH-$ 或いは $-C \equiv C-$ (3) R^1 はなくてもよいが、1 つまたは 2 以上あってもよく、環構成要素原子に結合する水素原子と置き換わるおぼえあり、それぞれ同一または異なる 2 つのロタン

基、シクロアルケン基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、 $-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-S(O)1-R^{12}$ 、 $-CO_2-R^{12}$ 、 $-CO-R^{12}$ 、 $-CON(R^{12})R^{13}$ 、 $-O-SO_2-R^{12}$ 、 $-SO_2-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{12})-CO-R^{13}$ 、置換アルキル基、置換アルケン基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基、置換ヘテロアリールアルキル基を表すか、または前記式(c)もしくは(d)を表す。前記及び後記の定義もしくは式において、

(1) R^7 は、水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表す。

(2) およびpは独立して0または1から3の整数(ただし、oとpは同時に0にならない)を表す。

(3) J^0 は酸素原子、または硫黄原子を表す。

(4) R^{14} は水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニルアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表す。

(5) 1 は0、1または2を表す。

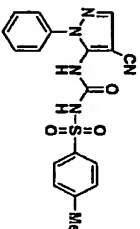
(6) R^8 及び R^9 は同一または互いに独立して水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基を表す。

(7) R^{12} および R^{13} は同一または異なるって、水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、置換アルキル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表す。

基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表す。

(8) 置換シクロアルキル基、置換アルケニル基、置換アルキニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基における置換基は、同一または異なるって1個又は2個以上あつてもよく、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロアリールアルキル基、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)R^9$ 、 $-CO-R^8$ 、 $-CS-R^8$ 、 $-CONR^8R^9$ 、 $-S(O)1-R^8$ 、 $-SO_2-N(R^8)R^9$ 、 $-N(R^8)-CO-R^9$ から選ばれる。但し、 R^8 が水素原子のときは R^1 は4-クロロフェニルまたは2-メチルフェニルを表し、 R^9 がアルキル基のときは R^4 はシアノ基を表し、

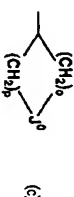
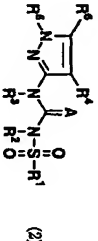
(c)式



で表される化合物を除く。)で表される化合物またはそれらの薬学的に許容される類似体もしくはアラルカリ付加体。

[請求項8] 一般式(2)

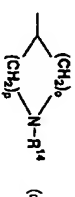
[化28]



(c)

もしくは式(d)

[化30]



(d)

を表す。 R^2 および R^3 はそれぞれ同一または異なるっていてもよく、水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表すか、または前記式(c)もしくは(d)を表す。 R^4 はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニルアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表すか、または前記式(c)もしくは(d)を表す。 R^6 は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基、置換ヘテロアリールアルキル基を表すか、または前記式(c)もしくは(d)を表す。

(c)式

アルキル基、シクロアルキルアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、 $-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-S(O)1-R^{12}$ 、 $-CO_2-R^{12}$ 、 $-CO-R^{12}$ 、 $-CS-R^{12}$ 、 $-O-CO-R^{12}$ 、 $-CON(R^{12})R^{13}$ 、 $-O-SO_2-R^{12}$ 、 $-SO_2-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-N(R^{12})-CO-R^{13}$ 、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基、置換ヘテロアリールアルキル基を表すか、または前記式(c)もしくは(d)を表す。前記及び後記の定義もしくは式において、

(1) R^7 は、水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表す。

(2) およびpは独立して0または1から3の整数(ただし、oとpは同時に0にならない)を表す。

(3) J^0 は酸素原子、または硫黄原子を表す。

(4) R^{14} は水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニルアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表す。

(5) 1 は0、1または2を表す。

(6) R^8 及び R^9 は同一または互いに独立して水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基を表す。

(7) R^{12} および R^{13} は同一または異なるって、水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、置換アルキル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を表す。

基、置換アリール基、置換ラルキル基、置換ヘテロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を指す。

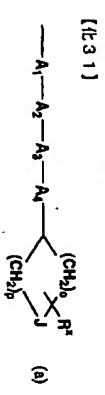
(8) 置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アルキニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換アリール基、置換アラールキル基、置換ヘテロアルケニルアルキル基、アリール基、アラールキル基、ヘテロアリールアルキル基、 $-OR^8$ 、 $-N(R^8)$ 、 R^9 、 $-CO-R^8$ 、 $-CS-R^8$ 、 $-CO_2-R^8$ 、 $-O-CO-R^8$ 、 $-CON(R^8)$ 、 R^9 、 $-S(O)1-R^8$ 、 $-SO_2-N(R^8)$ 、 R^9 、 $-N(R^8)$ 、 $-CO-R^9$ から選ばれる。) で表される化合物またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項8】 R^1 が、アリール基、置換アリール基、アルキル基、置換アルキル基、シクロアルキル基、置換シクロアルキル基または置換アラールキル基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項10】 R^2 及び R^3 の少なくとも一方が水素原子、アルキル基、置換アルキル基またはアラールキル基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項11】 R^4 が水素原子、シアノ基、メチル基、又はエチル基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項12】 R^5 がアルキル基、シクロアルキル基、アリール基、置換アルキル基、置換シクロアルキル基、置換アリール基、または式(a)



(式中、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、 R^6 、 J 、 n および p は請求項1と同じ意味を表す) で表される基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項13】 R^6 が水素原子、アルキル基、置換アルキル基、アリール基または置換アリール基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール

ル誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項14】 R^1 がシクロヘキシル基、フェニル基、2-ナフチル基、3-ナフチル基、3-トリル基、4-トリル基、3-エチルフェニル基、4-エチルフェニル基、3- n -プロピルフェニル基、4- n -プロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、3- n -ブチルフェニル基、4- n -ブチルフェニル基、3-イソブチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-フロモフェニル基、4-フロモフェニル基またはベンジル基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項15】 R^2 が水素原子、メチル基またはベンジル基であり、 R^3 が水素原子、メチル基、2-メトキシエチル基またはベンジル基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはその置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項16】 R^5 がフェニル基、エチル基、 n -プロピル基、イソプロピル基、シクロヘキシル基、シクロペンチル基、フェニル基、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イルまたはテトラヒドロ(4H)ービラゾール-4-イルである請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項17】 R^6 が水素原子、メチル基、エチル基、 n -プロピル基、 n -ブチル基、イソプロピル基、シクロヘキシル基、メチル基、メトキシカルボニルメチル基またはエトキシカルボニルメチル基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

【請求項18】 R^1 がアリール基、置換アリール基、アルキル基、置換アルキル基、シクロアルキル基、置換シクロアルキル基または置換アラールキル基であり、 R^2 および R^3 はそれぞれ同一または異なるかつてもよく、各々水素原子、アルキル基、置換アルキル基またはアラールキル基であり、

R^4 が水素原子またはシアノ基であり、 R^5 がアルキル基、シクロアルキル基、アリール基、置換アルキル基、置換シクロアルキル基、置換アリール基または式(a) で表される基であり、

R^6 が水素原子、アルキル基、置換アルキル基、アリール基または置換アリール基である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付

加増。

【請求項19】 下記(1)～(26) いずれかの化合物である請求項4記載の5-スルホニルウレイドー(1H)ービラゾール誘導体またはそれらの薬学的に許容される置換加増もしくはアルカリ付加増。

(1) 5-13-(4-トルエンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-1-シクロヘキシル (1H)ービラゾール

(2) 5-13-(4-ベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-1-フェニル (1H)ービラゾール

(3) 5-13-(4-トルエンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(4) 5-13-(4-トルエンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-エチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(5) 5-13-(4-トルエンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(6) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-1-フェニル (1H)ービラゾール

(7) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(8) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-エチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(9) 5-13-(4-トルエンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(10) 5-13-(4-トルエンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-エチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(11) 5-13-(4-トルエンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(12) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(13) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(14) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(15) 5-13-(4-イソプロピルベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-1-フェニル (1H)ービラゾール

エニル (1H)ービラゾール

(17) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(18) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(19) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(20) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(21) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(22) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(23) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(24) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(25) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

(26) 5-13-(4-クロロベンゼンシルホニル)ーウレイドー4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)ービラゾール

【発明の詳細な説明】

【0001】
【発明の属する分野】 本発明は新規なスルホニルウレイドービラゾール誘導体またはその薬理学的に許容される塩からなるベンゾトセリン変換酵素阻害剤、およびこのエンゾトセリン変換酵素阻害剤を有効成分とする循環器系疾患などの各種疾患の治療薬、および予防薬に関するものである。

【0002】

【従来の技術】 エンドセリン (以下、ETと略す) は血管内皮細胞の培養上清から単離された21アミノ酸残基からなる強力な血管収縮ペプチドである (Yanagisawaら, Nature, 322, 411-415, 1988)。ETは生体内で強い血管収縮作用、細胞増殖作用を有し、血管など各種臓器で生産される生理的に重要な役割をばたしていると考えられている。またETはその作用から高血圧、ラモゲ下出血後の脳血管梗死、心筋梗死、動脈硬化、腎不全、心不全、喘息等の疾患の成立に関わっていると考えられて

いる。また、レイノー患者、バーンジャー病患者、高安病
患者、川崎病患者、シスアラミアン発作時の腎臓病患者の血
液中などにおいてET濃度が正常人比として有意に高い
ことが知られている。ETはその生合成において、活性
の低い前駆体であるビッグエンヂン(以下、big
ETと略す)から特異的プロテアーゼであるET変換酵素
(ECEと略す)により生成される。従って、ECE
を阻害しETの生合成を抑えることは上記の各種疾患の
治療および予防に有効であると考えられる。これまで、
ECEを阻害する化合物としてはスリムトアセス・
クナシエンチン等の放線菌によって生産されるペネホラ
ミドンが知られている。学術報告会城大学薬学部(199
2)、第28巻、49-59頁、特開平1-47757、特開昭6
2-148482、Indian J. Chem., sect. B(1986)、258
(1993) 934-938、Pol. J. Pharmacol., Pharm. (1974)、26(4)、47
9-482、W092/104801)はスリムトアセス・クナシエンチン
誘導体が阻害しているが、そのメカニズムが変換酵素
阻害剤としての作用は全く不明であった。

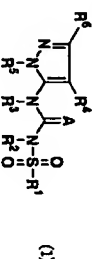
【0003】

【説明が解決しようとする課題】上記理由から、ECEを阻害する物質の精製が求められることであり、そしてこのECEを阻害する物質の精製によって、ETに起因する、または起因すると考えられる各種疾患、例えば不整脈、不安定狭心症、心肥大、高血圧、気管収縮（肺気腫、慢性気管支炎）、神経性障害（脳血管性痴呆、くも膜下出血、脳卒中、脳梗塞、アルツハイマー病）、分泌系不全（子宮症）、血管障害（動脈硬化、バジゼー病、高血圧性脈硬化、レイノ病、糖尿病の合併症）、潰瘍（胃潰瘍）、腫瘍（膀胱癌）、胃腸腸癌、エントロキシンツリゾック、敗血症、腎臓癌（急性および慢性腎不全）などの治療薬および予防薬の新たな開発の可能性が明かされることとなる。すなわち本発明は、ECEを阻害する物質の精製と、このECEの阻害作用に基づいた上記各種疾患の治療薬および予防薬の開発とを意味するものである。

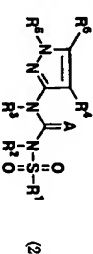
【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、ET変換酵素群と阻害剤について鋭意研究を試みた結果、下記一般式で示される化合物が上記の公知化合物よりも格段に優れた阻害活性を有することを見出し、本発明を完成するに至った。即ち、本発明は、

①一般式(1)もしくは(2)
【化32】

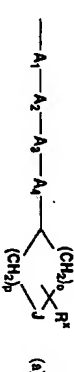


【1533】



[式中、Aは酸素原子または硫黄原子を表す。R¹はアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シロアルキル基、シクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、-OR¹-、SR¹-、NR¹-、R¹N⁺、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アルキニル基、置換シクロアルキル基、置換シリール基、置換アラルケニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シリール基、置換アラルケニル基、置換シクロアルキル基、または置換ヘテロアリールアルキル基、または式(6)の置換を要するか、または式(6)

(化3.4)



もしくは式 (b)
【化35】



を扱う。R² および R³ はそれぞれ同一または異なる二
いてよく、各々水素原子、アルキル基、アラルケニ
ル基、アリール基、シクロアルキル基、シクロアルケ
ニル基、フェリール基、ヘテロ環基、ヘテロアルケ
ニル基、置換アルキル基、置換アルケン基、置換アル
キニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケ
ニル基、置換クロロアルキル基、置換クロロアルケ
ニルアルキル基、置換シリール基、置換アルキル基、
置換クロロ環基、または前記式(a)もしくは(b)を複
合する。

す。R4およびR6 はそれぞれ同一または異なる任意の置換基、各々水素原子、ハロゲン原子、シアミド基、ニトロ基、アルキル基、シクロアルキル基、アルキル基、エーテル基、アールキル基、シアロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基、-OR¹²、-N(R¹²)、R¹³、-CO-R¹²、-CS-R¹²、-CO₂-R¹²、-CO-S-R¹²、-CS₂-R¹²、-CS₃-R¹²、-O-CO-R¹²、-O-CO-S-R¹²、-O-CO-R¹²、-S-CO-R¹²、-S-CS-R¹²、-CON(R¹²)、-CSN(R¹²)、R¹³-S(O)-R¹²、-S

$02-N(R^{12})$ R^{13} , $-N(R^{12})$, $-CO-R^{13}$,
 OSO_2-R^{12} , 置換アルキル基, 置換アルケニル基,
 置換アルキニル基, 置換シクロアルキル基, 置換シロ
 アルケニル基, 置換シクロアルキル基, 置換アリール基, 置換ア
 ルキル基, 置換ヘテロアリールアルキル基, もしくは置
 換ヘテロ環基を表すか, または前記式 (a) もしくは (b) を表す。
 (b) を表す。 R^{15} は, 水素原子, アルキル基, アルケ
 ニル基, アルキニル基, シクロアルキル基, シクロアル
 ケニル基, アリール基, ヘテロ環基, ヘテロアリールア
 ルキル基, $-CO-R^{12}$, $-CS-R^{12}$, $-CO_2-$
 R^{12} , $-CO-S(R^{12})$, $-CS_2-R^{12}$, $-CS-O-$
 R^{12} , $-CON(R^{12})$ R^{13} , $-CSN(R^{12})$
 R^{13} , $-S(O)1-R^{12}$, もしくは $-SO_2-N(R^{12})$ (R
 12) R^{13} , 置換アルキル基, 置換アルケニル基, 置換ア
 ルキニル基, 置換シクロアルキル基, 置換シクロアルケ
 ニル基, 置換シクロアルキル基, 置換シクロア
 ルケニルアルキル基, 置換アリール基, 置換アルキル
 基, 置換ヘテロ環基, もしくは置換ヘテロアリールアル
 キル基を表すか, または前記式 (a) もしくは (b) を表
 す。前記及び後記の定義もしくはは式において,

(1) R^7 及び R^7_1 は同一または互いに独立して

子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、ヘテロアリール基、ヘテロ環基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換アリール基、置換アルキル基、置換ヘテロ環基、または置換ヘテロアリール基を置す。ただし、-N(R¹)の場合に、R¹及びR¹が互いに結合して、それらから結合する窒素原子と共に、環中に他のシクロ原子を含んでもよい値が3ないし8員環を致してもよい。

(2) A¹、A²、A³、およびA⁴は同一または異なる各々環結合もしくは、-CH₂-を致すか、または隣り合う二つの一緒になつて-CH=CH-或いは-C≡C-を致す。

(3) R₁Mはなくてもよいが、1つまたは2以上あってもよく、環状低酸素原子に結合する水素原子を置き換わる基であり、それと同一または異なる α -ロレンジ原子、ニトロ基、シアノ基、アルキル基、アルニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロアリールアルキル基、ヘテロ環基、または-A5-A6-A7-A8-F_n-Yを致す。

(4) o および p は独立して 0 または 1 から 3 の整数 (ただし、 o と p は同時に 0 にならない) を選ぶ。

(5) J は酸素原子、または $-\text{S}(\text{O})_q-$ (式中、 q は 0、1、または 2 を表す) を表す。

(12)

(6) R は水素原子、アルキル基、アラルキニル基、アリール基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アリール基、置換アラルキニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換ジクロアルキル基、置換ジクロアルケニル基、置換トリクロアルキル基、置換トリクロアルケニル基、置換テトラクロアルキル基、置換テトラクロアルケニル基、置換ペンタクロアルキル基、置換ペンタクロアルケニル基、置換ヘキサクロアルキル基、置換ヘキサクロアルケニル基、置換ヘptaクロアルキル基、または置換ヘテロアリールアルキル基を意味する。

(7) A5、A6、A7およびAgは同一または異なつて各々単結合、もしくは-CH₂-を数すか、または隣り合う二つが一緒になつて-CH=CH-或いは-C≡C-を数す。

$$\begin{array}{l} \text{R}^8, \text{--CS--R}^8, \text{--CO}_2\text{--R}^8, \text{--CO--S}^8, \\ \text{R}^8, \text{--CS}_2\text{--R}^8, \text{--CS--O--R}^8, \text{--O--CC--R}^8, \\ \text{--R}^8, \text{--O--CS--R}^8, \text{--S--CO--R}^8, \text{--S--} \\ \text{CS--R}^8, \text{--CON(R}^8\text{)R}^9, \text{--CSN(R}^8\text{)R}^9, \\ \text{R}^9, \text{--S(O)I--R}^8, \text{--SO}_2\text{--N(R}^8\text{)R}^9, \\ \text{R}^9, \text{--O--CO}_2\text{--R}^8 \text{ または --N(R}^8\text{) --CO--} \\ \text{R}^9 \text{ を既す,} \end{array}$$

(9) 1 は 0 、 1 または 2 を返す。

(10) R^2 及び R^3 は同一または互いに独立してそれぞれ原子、アルキル基、アリール基、アルキニル基、シロアルキル基、シロアリール基、シロアルケニルアルキル基、シロアリール基、アラキル基、シクロアルケニルアルキル基、またはヘテロアリールアルキル基を致す。ただし、 $-N(R^8)R^9$ 、 $-CON(R^8)R^9$ 、または $-CSN(R^8)R^9$ 、 $-SO_2-N(R^8)R^9$ 、または $-N(R^8)R^9$ 、 $-CO-R^9$ の場合には R^8 及び R^9 は互いに結合して、それらが結合する位置を環（及び炭素原子と）一軸になって、環中に他のへリ原子（及び炭素原子と）一軸になって、環中に他のへリ原子を含んでもよい飽和3ないし8員環を致してもよい。ただし、 $-O-CO-R^8$ 、 $-O-CO-R^8$ 、 $-S-CO-R^8$ 、 $-S-CO-R^8$ 、 $-SO-R^8$ または $-SO_2-R^8$ のときは、 R^8 は水素原子でない。

[illegible]

(12) 置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アリ

キニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルキル

アルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアル

ケニルアルキル基、置換アリール基、置換アリールアルキル

基、置換ヘテロアリールアルキル基、または置換ヘテロ

環基における置換基は、同一または異なる1個または

2個以上あってもよく、ハロゲン原子、ニトロ基、シア

ノ基、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シク

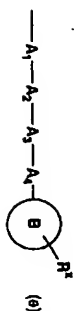
ロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、シクロアル

ケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、

アラルキル基、ヘテロアリールアルキル基、-A5-A6

-A7-A8-R¹、または式(e)

〔化36〕



(式中、B環はシクロアルキル基、シクロアルケニル

基、アリール基またはヘテロ環基を表す) から選ばれ

る。ただし、当該置換基が置換シクロアルキル基、置換

シクロアルケニル基、置換シクロアルキルアルキル基、

置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置

換アリールアルキル基、置換ヘテロ環基、もしくは置換ヘテロ

アリアルキル基における置換基である場合には、隣

接する炭素原子に結合する置換基と結合し、該炭

素原子と一緒になって、4～8員環を形成してもよ

い、] で表される化合物またはそれらの薬学的に許容さ

れる置付加塩もしくはアルカリ付加塩を含有するエンピ

セリン変換酵素阻害剤、

⑨前記一般式(1)もしくは(2)で表される化合物ま

たはそれらの薬学的に許容される置付加塩もしくはアル

カリ付加塩を含有する循環器系の疾患、気管収縮、神経

性障害、分枝系不全、血管障害、潰瘍、腫瘍、胃腸障害

害、エンドキシンショック、敗血症、または腎臓の

治療または予防薬、

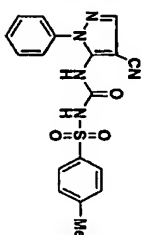
⑩前記一般式(1)で表わされる5-スルホニルウレイ

ド- (1H) -ピラゾール誘導体、(但し、以下の化合

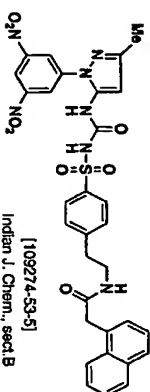
物を除く。

i) 下記式

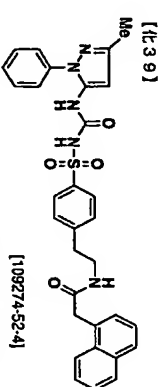
〔化37〕



〔化38〕

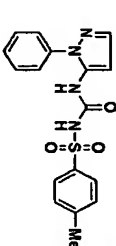


〔化39〕



Indian J. Chem., sect. B
834, 258(9), (1986)

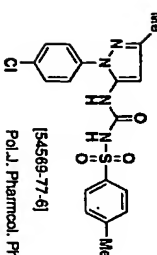
〔化40〕



[54644-70-1]

Pol. J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

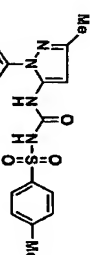
〔化41〕



[54569-77-6]

Pol. J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

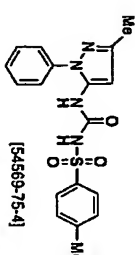
〔化42〕



[54569-76-5]

Pol. J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

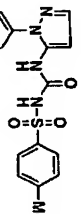
〔化44〕



[54569-75-4]

Pol. J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

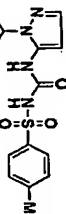
〔化45〕



[54569-74-3]

Pol. J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

〔化46〕

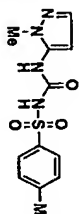


[54569-73-2]

Pol. J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

または

〔化47〕



[54569-72-1]

Pol. J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)



[144849-10-5]

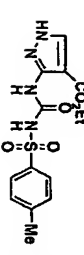
学術報告名城大学農学部



[144849-11-6]

学術報告名城大学農学部

〔化48〕



[144849-10-5]

学術報告名城大学農学部

48, 28, (1992)

12) R13, -OR12, -S (O) | -R12, -CO2 -

R_{12} , $-CO-R_{12}$, $-CS-R_{12}$, $-O-CO-$
 R_{12} , $-CON(R_{12})R_{13}$, $-OSO_2-R_{12}$, $-S$
 $O_2-N(R_{12})R_{13}$, $-N(R_{12})-CO-R_{13}$, 置
 換ジアルキル基、置換アルケニル基、置換
 シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換
 アルキル基、置換アリール基、置換アラキル基、置換ヘテ
 ロ環基または置換ヘテロアリールアルキル基を致すか、
 または前記式 (c) もしくは (d) を致す。R⁵は、ア
 ルケニル基、アルキル基、シクロアルキル基、シクロ
 アルケニルアルキル基、アリール基、アラキル基、ヘテロ
 ケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ
 環基、ヘテロアリールアルキル基、 $-S(O)_1-R$
 $_{12}$, $-CO_2-R_{12}$, $-CO-R_{12}$, $-CS-R_{12}$, $-$
 $CON(R_{12})R_{13}$, $-SO_2-N(R_{12})R_{13}$, 置換
 アルキル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置
 換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロ
 アルケニルアルキル基、置換シクロアルケニルアルキ
 ル基、置換アリール基、置換アラキル基、置換ヘテロ
 環基、置換ヘテロアリールアルキル基を致すか、または
 前記式 (c) もしくは (d) を致す。R⁶は、無環子、
 ハロゲン原子、ジアルキル基、ニトロ基、アルキル基、アル
 ケニル基、アルキル基、シクロアルキル基、シクロアルケ
 ニル基、置換シクロアルケニル基、シクロアルケニル
 アルキル基、置換シクロアルケニル基、シクロアルケニ
 ルアルキル基、アリール基、アラキル基、ヘテロ環基、ヘテ
 ロアリールアルキル基、 $-N(R_{12})R_{13}$, $-$
 OR_{12} , $-S(O)_1-R_{12}$, $-CO_2-R_{12}$, $-CO$
 R_{12} , $-CS-R_{12}$, $-O-CO-R_{12}$, $-CON$
 $(R_{12})R_{13}$, $-OSO_2-R_{12}$, $-SO_2-N(R_{13})$
 $(R_{12})R_{13}$, $-N(R_{12})-CO-R_{13}$, 置換アルキ
 ル基、置換アルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロ
 アルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアル
 ケニルアルキル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置
 換ヘテロアリールアルキル基、置換ヘテロ環基、置
 換アラキル基、置換アラキル基を致すか、または前記式
 (c) もしくは (d) を致す。前記及び後記の定義もし
 は式において、

[illegible]

(5) 1 は 0 、 1 または 2 を表す。

(6) R⁸ 及び R⁹ は同一または互いに独立して水素原子、
 子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロ
 アルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルキルアル
 キル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、ア
 ルキル基、シクロアルケニルアルキル基、ヘテロアルキ
 ル基、ヘテロアリールアルキル基を被す。

シクロアルケニルアルキル基
れる。アルケニル基としては
2-プロペニル、1-ブテニ
ニル、4-ペンテニル、2
ニル、1-ヘプテニル、1-
ル、3-ヘキセニル、4-
ル、1-ヘプテニル、2-
ル、4-オクタニル、5-
ル、1-オクタニル、2-
ル、4-オクタニル、5-
ル、7-オクタニル、など
の
子数2~8個のアルケニル基
【0066】アルキル基と
1-プロピニル、2-ブ
テニル、3-ブテニル、1
ニル、3-ペンテニル、4-
ル、2-ヘキシニル、3-
ル、5-ヘキシニル、1-
ル、

(7) R₁およびR₁₃は同一または異なる、水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルキニル基、アリール基、アリール基基、シクロアリール基、シリール基、フルオリール基、ヘテロ環基、置換フルキル基基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルキニル基、置換フェニル基、置換アリール基、置換シリール基、置換フルキル基、置換ヘテロ環基、置換ヘテロアリール基、置換フルキル基基を被置換する。

(8) 直換アルキル基、直換アルケニル基、直換アリール基、直換シクロアルキル基、直換クロロアルケニル基、直換シクロアルキル基、直換フルオロアルケニル基、直換シリール基、直換アミール基、直換ニトリアルキル基、直換ヘテロ環基または直換ヘテロアリールアルキル基における直換基は、同一または異なる1個又は2個以上あってもよく、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、アルキル基、アルケニル基、アリール基、シクロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロフルオロアルケニル基、シクロアリール基、シクロアミール基、シクロニトリアルキル基、シクロヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、 $-OR^8$ 、 $-NR^8R^9$ 、 $-CO-R^8$ 、 $-CS-R^8$ 、 $-CO_2-$

$$\begin{array}{l} R^8, -OCO-R^8, -CONR^8R^9, -S(O) \\ | \\ -R^8, -SO_2-NR^8R^9, -N(R^8)-CO \\ -R^9 \text{ から選ばれる。}] \text{で表される化合物またはそれら} \\ \text{の環学的に許容される融付加値もしくはアルカリ付加} \\ \text{値に関する。}\end{array}$$

【00005】本発明における各種の基を以下に説明する。アルキル基としては、例えばメチル、エチル、プロピル、2-ブチル、ブチル、2-ペンチル、2-ヘキシル、1-ペンチルエチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、などの直鎖または分岐した炭素原子数8個以下のアルキル基が挙げられる。飽和アルキル基としては好ましくはシクロアルキルアルキル基、

(18)

シクロアルケニルアルキル基、アラルキル基が挙げられる。アルケニル基としては、例えばビニル、アリル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、4-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、2-ヘキサニル、1-ヘプテニル、2-ヘプテニル、3-ヘプテニル、4-ヘプテニル、5-ヘプテニル、6-オクタニル、1-オクタニル、2-オクタニル、3-オクタニル、4-オクタニル、5-オクタニル、6-オクタニル、7-オクタニル、などの直鎖または分岐した炭素原子数9～8個のアルケニル基が挙げられる。

【0006】アルキニル基としては、例えばエチニル、

[illegible]

無原子数4～14個のシクロアルケンアルキル基が挙げられる。アリール基としては、例えばフェニル、ナフチルなどの炭素原子数10個以下のアリール基が挙げられる。

ル、5-ヘキシル、1-ヘプチル、2-ヘプチル、3-ヘプチル、4-ヘプチル、5-ヘプチル、6-ヘプチル、1-オクチル、2-オクチル、3-オクチル、4-オクチル、5-オクチル、6-オクチル、7-オクチルなどの直鎖または分枝した飽和原子数2～8個のアルキル基が挙げられる。

[0009] アラキル基としては、例えばペンジル、
1-エニルエチル、2-エニルエチル、3-アエニ
ルプロピル、2-アエニルプロピル、1-アエニルブ
チル、4-アエニルブチル、3-アエニルブチル、2-
エニルオクチル、1-アエニルオクチル、1-オクタ
リルメチル、1-アエニルメチル、1-オクタリル
メチル、2-オクタリルメチル、2-(1-オクタリル)
エチル、2-(2-オクタリル)エチル、3-(1-オクタ

【0000】シクロアルキル基としては、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプタール、シクロオクタール、シクロノナール、デカリン、シス-デカリン-2-エール、トランス-デカリン-2-エールなどの炭素原子数3～12個のシクロアルキル基が挙げられる。シクロアルキル基が4～14個のシクロアルキル基が挙げられる。シクロアルキル基としては、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプタール、シクロオクタール、シクロノナール、デカリン、シス-デカリン-2-エール、トランス-デカリン-2-エールなどの炭素原子数3～12個のシクロアルキル基が挙げられる。シクロアルキル基が4～14個のシクロアルキル基が挙げられる。

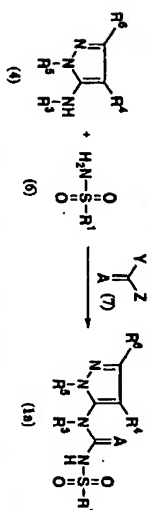
チル) - フロピル、2 - (2 - ナフチル) - フロピル、
4 - (1 - ナフチル) - フチル、3 - (2 - ナフチル)
- フチルなどの炭素原子数 14 以下のアリール基が等
げられる。

[0010] ヘテロ環基としてはヘテロアリール基、ま
たは酸素、硫黄、窒素原子から選ばれた 2 つの他のヘテ
ロ原子と炭素原子で構成される 5 ~ 6 員環の不飽和環状
環として 2 - ピベンジル、1 - モルホリニル、2 - モル
ホリニル、3 - モルボリニル、モルボリノなど挙げられ
る。不飽和環状環としてはイミダゾリニン、イメル
ドなど挙げられる。ヘテロアリの基としては、例えば
置換基を 1 ~ 4 個含む 5 ~ 6 員環の基、置換基を 1

【0000】 シクロアルケニル基としては、例えば、1-シクロブテニル基、1-シクロペンチニル基、2-シクロペンチニル基、3-シクロペンチニル基、1-シクロヘキセニル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基、4-シクロヘキセニル基、1-ヘプタニル基、2-ヘプタニル基、3-ヘプタニル基、1-オクタニル基、2-オクタニル基、3-オクタニル基、4-オクタニル基などの炭素原子数3〜8個のシクロアルケニル基が挙げられる。シクロアルケニル基としては、例えば、1-シクロブテニル基、1-シクロペンチニル基、2-シクロペンチニル基、3-シクロペンチニル基、1-シクロヘキセニル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基、4-シクロヘキセニル基、1-ヘプタニル基、2-ヘプタニル基、3-ヘプタニル基、1-オクタニル基、2-オクタニル基、3-オクタニル基、4-オクタニル基などの炭素原子数3〜8個のシクロアルケニル基が挙げられる。

ー2個と酸素原子を1個もしくは硫黄原子を1個を含む
 5ー6員環の基、酸素原子を1個もしくは硫黄原子を1
 個と2ー5員環の基、あるいは上記の環とは結合した
 環と2ー5員環もしくはナフタリ環が適宜に基が等
 げられる。具体的には、2ーピリジル、3ーピリジル、
 4ーピリジル、2ーチエニル、3ーチエニル、2ーフリ
 ル、3ーフリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラ
 ゾリル、ピラゾリル、ピロリル、2ーチアゾリル、3ー
 イソチアゾリル、2ーオキサゾリル、3ーイソオキサ
 ゾリル、2ーベンゾフリル、2ーベンゾチエニル、2ーキ
 ノリル、3ーキノリル、4ーキノリル、2ーベンゾド
 リル、3ー(1H)ーインダゾリル、8ーインドル、2ー
 キナゾリル、3ーキノゾリル、2ーナフチリニル、

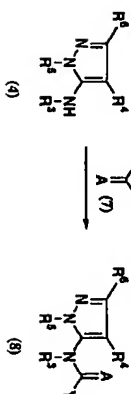
化カリウム、水素化カルシウムなどの金属水素化物、ナトリウム、フェニルリチウム、ナトリウムエトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ブトキシド、リチウムアミド、リチウムジエチルアルミニドなどの有機金属塩、トリエチルアルミニウム、ジエチルマグネシウム、トリエチルマグネシウム、溶媒としてはベンゼン、トルエンなどの芳香族性炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどのアミド系溶媒、テトラヒドロフラン、エーテル、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタンなどの



【式中、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様であり、YおよびZは求核攻撃により容易に置換しうる脱離基を表す】

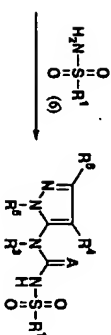
本反応において、使用される塩基および溶媒は前記(B)で述べたものと同様の物が挙げられる。

(D) 本発明化合物(1a)は、化合物(4)と1~5当量



量の化合物(7)とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得られる化合物(8)とし、これを1~5当量の化合物(6)とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより、得ることができる。

【化57】



(1a)

【式中、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶、YおよびZは前記と同様である。】

本反応において、使用される塩基および溶媒は前記(B)で述べたものと同様の物が挙げられる。

(E) 本発明化合物(1a)は、化合物(6)と1~5当量

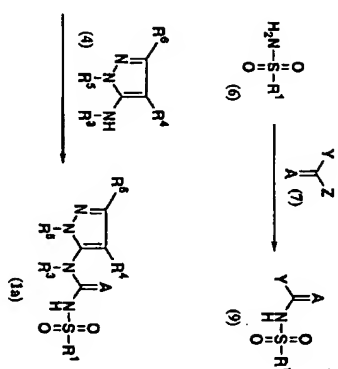
量の化合物(7)とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒

エーテル系溶媒、トリジンなどの塩基性溶媒、またはそれらの混合溶媒が挙げられる。式(5)で表される原料化合物は市販されているか、もしくは文献記載の方法で合成することができる。【例えば、特開昭51-26816、10 tetrahedron letters, 34, 2839, (1993)】

【0015】(C) 本発明化合物(1a)は、化合物

(4)と1~5当量の化合物(6)とを適当な塩基および1~5当量の化合物(7)の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下、反応させることにより得ることができる。

【化56】



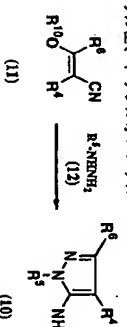
【式中、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶、YおよびZは前記と同様である。】

基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、トリメーロメチル基等のトリハロメチル基及びハロゲン原子等が挙げられる。

本反応において、使用される塩基および溶媒は前記(B)で述べたものと同様の物が挙げられる。化合物(7)、(8)及び(9)において、脱離基Y及びZとしては同一もしくは互いに独立して、低級アルコキシ基、アラルキロキシ基、アリールオキシ基、置換アリールオキシ基、1-イミダゾリル基、トリフルオロメチル

【0016】(F) 原料化合物(4)は下記方法により化合物(10)及び化合物(4')として製造すること

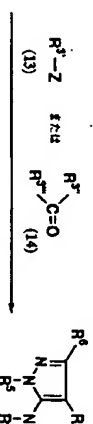
【化59】



(11)

(12)

(10)



(13)

(14)

(4')

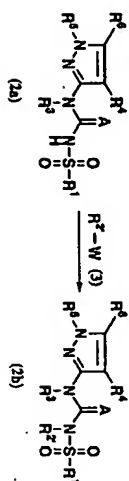
【式中、R⁴、R⁵、Zは前記と同様であり、R³はR³と同じ意味を表し(但し水素原子は除く)、R³'およびR³''は-CH(R³')R³''がR³(但し、α位に水素原子を持つ基に限る)と同じ意味になる様な基を表し、R¹⁰はアルキル基を表す。】

(1991)、特開平6-503069号、J. Am. Chem. Soc., 81, 2456, (1959)、Chemical abstract, 79, 146518, Heterocycles, 26, 613, (1987)、J. Org. Chem. 58, 61 55, (1993)の方法で合成することができるか、あるいは化合物(11)と1~5当量の化合物(12)とを通常用いられる溶媒中、酸或いは塩基の存在下、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。化合物(10)と化合物(13)とを反応させる場合は、塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸バリウム、炭酸ストロンチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素セシウム、炭酸水素バリウム、炭酸水素ストロンチウム、炭酸水素カリウムなどの無機塩基、水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの無機塩基、水素化カルシウムなどの金属水素化物、ナトリウム、フェニルリチウム、ナトリウムエトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ブトキシド、リチウムアミド、リチウムジエチルアルミニドなどの有機金属塩基、トリエチルアル

【式中、R⁴、R⁵、Zは前記と同様であり、R³はR³と同じ意味を表し(但し水素原子は除く)、R³'およびR³''は-CH(R³')R³''がR³(但し、α位に水素原子を持つ基に限る)と同じ意味になる様な基を表し、R¹⁰はアルキル基を表す。】

(1991)、特開平6-503069号、J. Am. Chem. Soc., 81, 2456, (1959)、Chemical abstract, 79, 146518, Heterocycles, 26, 613, (1987)、J. Org. Chem. 58, 61 55, (1993)の方法で合成することができるか、あるいは化合物(11)と1~5当量の化合物(12)とを通常用いられる溶媒中、酸或いは塩基の存在下、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。化合物(10)と化合物(13)とを反応させる場合は、塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸バリウム、炭酸ストロンチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素セシウム、炭酸水素バリウム、炭酸水素ストロンチウム、炭酸水素カリウムなどの無機塩基、水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの無機塩基、水素化カルシウムなどの金属水素化物、ナトリウム、フェニルリチウム、ナトリウムエトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ブトキシド、リチウムアミド、リチウムジエチルアルミニドなどの有機金属塩基、トリエチルアル

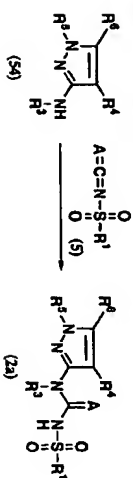
ン、ピリジン、ジイソプロピルエチルアミンなどの有機塩基が、溶媒としてはベンゼン、トルエンなどの芳香族性炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどのアミド系溶媒、テトラヒドロフラン、エーテル、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタンなどのエーテル系溶媒、ピリジンなどの塩基性溶媒、またはそれらの混合溶媒が挙げられる。化合物(10)を化合物(14)で還元剤 N-アルキル化を行う場合は、化合物(10)と化合物(14)を水素化シアノほう素ナトリウム



および適当な酸の存在下、一般的に用いられる溶媒中、冷却下、室温下または加熱下反応させることにより得ることができるか、或いは化合物(10)と化合物(14)を適当な酸および触媒の存在下、水素雰囲気下で接触還元反応を行うことにより得ることができる。【0017】(G) 本発明化合物(2b)は、化合物(2a)と1~5当量の化合物(3)とを適当な塩基の存在下、通常用いられる溶媒中、冷却下、室温下または加熱下反応させることにより、合成することができる。【化60】

【式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様である。】

本反応で使用する溶媒および溶媒としては前記(A)で述べたものと同様のものが挙げられる。一般式(2a)で表される本発明化合物は、例えば以下(H)~(K)に示す方法によって製造することができる。

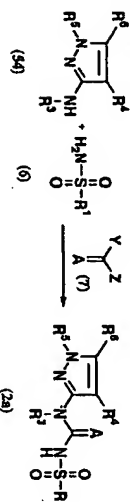


(H) 本発明化合物(2a)は、化合物(54)と1~5当量の化合物(5)とを塩基の存在下取いは非存在下、通常用いられる溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。【化61】

【式中、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様である。】

本反応において使用される塩基および溶媒としては前記(B)で述べたものと同様のものが挙げられる。

(1) 本発明化合物(2a)は、化合物(54)と1~5当



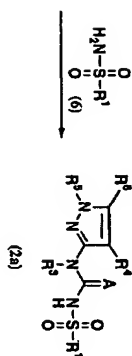
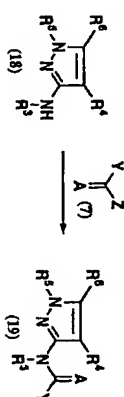
量の化合物(6)とを適当な塩基および(7)の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下、反応させることにより得ることができる。【化62】

【式中、Y、Z、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様である。】

本反応において使用される塩基および溶媒としては前記(B)で述べたものと同様のものが挙げられる。

【0018】(J) 本発明化合物(2a)は、化合物(18)と1~5当量の化合物(7)とを適当な塩基の存在

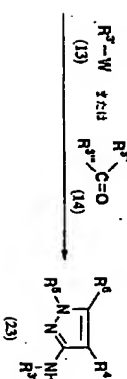
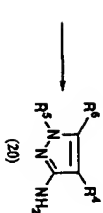
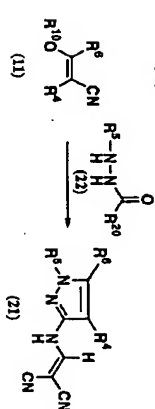
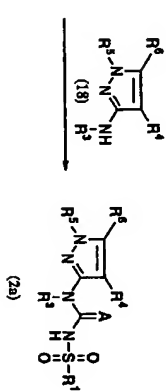
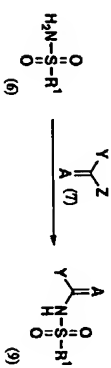
下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより化合物(19)とし、これを1~5当量の化合物(6)と適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより、得ることができる。【化63】



【式中、Y、Z、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様である。】

本反応において使用される塩基および溶媒としては前記(B)で述べたものと同様のものが挙げられる。

(K) 本発明化合物(2a)は、化合物(6)と1~5当量の化合物(7)とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。【化64】



【式中、Y、Z、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様である。】

本反応において使用される塩基および溶媒としては前記(B)で述べたものと同様のものが挙げられる。

【0019】(L) 式(18)で表される化合物は以下の方法により化合物(20)及び化合物(23)として得ることができる。【化65】

表 2

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	CF ₃ -
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CN
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表3】

表 3

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CF ₃ -
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CN
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表4】

表 4

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Me
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Et
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ Pr
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁱ Pr
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Bu
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Bu
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CF ₃
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl- Ph
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Pyridyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Pyridyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	4-Pyridyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Furyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Furyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Thienyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Thienyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CN
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CO ₂ H
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ OH
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ OMe
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表5】

表 5

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Me
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Et
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ Pr
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁱ Pr
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Bu
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Bu
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl- Ph
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Pyridyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Pyridyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	4-Pyridyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Furyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Furyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Thienyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Thienyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CN
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CO ₂ Et
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CO ₂ H
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ OH
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ OMe
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【0023】

【表6】

表 6

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CF ₃ -
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表7】

表 7

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表8】

表 8

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Me
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Et
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	^t Bu
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Ph
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CN
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表9】

表 9

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Me
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Et
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	^t Bu
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Ph
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CN
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表10】

表 10

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Me-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Et-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ Pr-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁱ Pr-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ Bu-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Bu-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclopentyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Ph-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Pyridyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Pyridyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	4-Pyridyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Furyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Furyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Thienyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Thienyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CN
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[0024]

[表 11]

表 11

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Me-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Et-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ Pr-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁱ Pr-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ Bu-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Bu-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclopentyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	Ph-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	4-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Furyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Furyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Thienyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Thienyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CN
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3- ⁿ Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[表 12]

表 12

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表13】

表 13

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4 ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表14】

表 14

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CF ₃
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopropyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表15】

表 16

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopropyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表16】

表 16

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	C ₃ -
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 17】

表 17

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Bz-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 18】

表 18

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-F-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表19】

表 19

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4- ⁱ Pr-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表20】

表 20

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	^{ipr} -
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	^{ipr} -
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	^{bu} -
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	^{bu} -
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[0025]

【表 21】

【表 22】

表 21

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	^{ipr} -
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	^{ipr} -
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	^{bu} -
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	^{bu} -
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 22

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表23】

表 23

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表24】

表 24

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Me
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Et
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	^t Bu
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Ph
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CN
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 2 5】

表 25

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Me
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Et
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	^t Bu
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Ph
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CN
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 2 6】

表 26

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	Me
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	Et
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ -Pr
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	^{iso} -Pr
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ -Bu
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	^{iso} -Bu
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclopentyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	Ph
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Pyridyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Pyridyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	4-pyridyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Furyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Furyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Furyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Thienyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Thienyl
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CN
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph	-(CH ₂) ₂ MMe ₂

【表27】

(52)

表 27

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	"Pr"-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	"Pr"-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	"Bu"-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	"Bu"
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CH ₃
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4H ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表28】

表 30

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0026】

【表31】

【表32】

表 31

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 82

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表33】

表 83

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表34】

表 84

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Cyclohexyl-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 35】

表 85

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 36】

28

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	"Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	"Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	"Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	C ₅ F-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl- Ph
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ SOH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ SOMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ NNMe ₂

【表37】

表 87

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Pr-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Isop-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表38】

表 38

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	C ₆ F ₅ -
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表39】

表 39

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Et-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表40】

表 40

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{iso} Bu-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{tert} Bu-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl- Ph-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₃ CN
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ COH
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

[0027]

[表41]

表 41

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{iso} Bu-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{tert} Bu-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl- Ph-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₃ CN
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ COH
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

[表42]

表 13

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{iso} Pr-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{iso} Bu-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表4.3】

表 13

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{iso} Pr-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{iso} Bu-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表4.4】

表 44

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 45】

表 45

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 46】

表 48

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	CF ₃ -
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 49】

表 49

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Bz-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 50】

表 60

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Pr
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Pr
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Bu
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[0028]

[表51]

[表52]

表 61

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Pr
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Pr
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Bu
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 52

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 5 3】

表 53

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 5 4】

表 54

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Pr-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Pr-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 55】

表 55

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Pr-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Pr-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 56】

表 56

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4H00C-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表57】

表 57

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表58】

表 58

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 59】

表 59

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 60】

表 60

[0029]

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Pr
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Pr
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	^t Bu
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[表 6 1]

[表 6 2]

表 61

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Pr
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Pr
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	^t Bu
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 63

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 6 3】

表 63

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 6 4】

按 84

λ	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	Me
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	Et
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	γ -Pr
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	η -Pr
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	η -Bu
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	η -Bu
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	Cyclopentyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	Cyclohexyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	Ph
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	2-Pyridyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	3-Pyridyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	4-Pyridyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	2-Furyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	3-Furyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	2-Thienyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	3-Thienyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	3-Thienyl
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	CH_3CN
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	$-CH_2CO_2Et$
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	$-CH_2CO_2H$
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	$-(CH_2)_2OH$
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	$-(CH_2)_2OMe$
0	$PhCH_2$	H	H	-ON	Ph	$-(CH_2)_2NH_2$

【表65】

表 65

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	Me-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	Et-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	ⁿ Pr-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	^{is} Pr-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	^{tert} Bu-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	^{tert} Bu-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	Cyclopentyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	Cyclohexyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	Ph-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	2-Pyridyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	3-Pyridyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	4-Pyridyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	2-Furyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	2-Thienyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	3-Furyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	2-Thienyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	3-Thienyl-
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	PhCH ₂	H	H	-ON	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表665】

表 66

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Me-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Et-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 67】

表 67

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Me-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Et-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 68】

表 68

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 69】

表 69

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 70】

表 70

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0030】

【表71】

【表72】

表 71

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 72

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 7 3】

表 73

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 7 4】

表 74

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 7 5】

表 75

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	^t Bu-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Bu-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CN
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 7 6】

表 76

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	^{is} Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	^{is} Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CN
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ OH
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表 7 7】

表 77

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	^{is} Pr-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	^{is} Bu-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CN
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ OH
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表 7 8】

表 78

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表79】

表 79

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Bu-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CN
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表80】

表 80

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0031】

【表81】

表 81

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表82】

表 82

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Me-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Et-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	^t Bu-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Ph-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CN
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 8 3】

表 83

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Me-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Et-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	^t Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 8 4】

表 84

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	^t Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表85】

表 85

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	^t Bu-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表86】

表 88

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 87】

表 87

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 88】

表 88

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表89】

表 89

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表90】

表 80

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0032】

【表 9 1】

表 81

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Me-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Et-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Ph-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 9 2】

表 92

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Me-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Et-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Pr-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Bu-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Ph-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 93】

表 93

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Me-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Et-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Ph-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 94】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Me-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Et-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	^t Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	^t Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Ph-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 95】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Me-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Et-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	^t Bu-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	^t Bu-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 96】

表 96

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	H	H	H	Me-	Me-
0	Me-	H	H	H	Me-	Et-
0	Me-	H	H	H	Me-	ⁿ Pr-
0	Me-	H	H	H	Me-	ⁱ Pr-
0	Me-	H	H	H	Me-	ⁿ Bu-
0	Me-	H	H	H	Me-	ⁱ Bu-
0	Me-	H	H	H	Me-	Cyclopentyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	Cyclohexyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	Ph-
0	Me-	H	H	H	Me-	2-Pyridyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	3-Pyridyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	4-Pyridyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	2-Furyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	3-Furyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	2-Thienyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	3-Thienyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CN
0	Me-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 97】

表 97

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	H	H	H	Me-	Me-
0	Ph-	H	H	H	Me-	Et-
0	Ph-	H	H	H	Me-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	H	H	Me-	ⁱ Pr-
0	Ph-	H	H	H	Me-	ⁿ Bu-
0	Ph-	H	H	H	Me-	ⁱ Bu-
0	Ph-	H	H	H	Me-	Cyclopentyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	Cyclohexyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	Ph-
0	Ph-	H	H	H	Me-	2-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	3-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	4-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	2-Furyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	3-Furyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	2-Thienyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	3-Thienyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CN
0	Ph-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 98】

表 98

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Ph-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表99】

表 99

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Me-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Et-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表100】

表 100

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Me
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Et
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁿ Pr
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁱ Pr
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁿ Bu
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁱ Bu
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Cyclopentyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Cyclohexyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Ph
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	4-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Furyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Furyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Thienyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Thienyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ ON
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0033】

【表101】

表 101

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Me
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Et
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁿ Pr
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁱ Pr
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁿ Bu
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁱ Bu
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Cyclopentyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Cyclohexyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Ph
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	4-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Furyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Furyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Thienyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Thienyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ ON
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表102】

表 103

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表103】

表 103

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表104】

表 104

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表105】

【表106】

表 105

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 108

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ ON
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表107】

表 107

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ ON
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表108】

表 108

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ ON
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 109】

表 109

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ ON
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 110】

表 110

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[0034]

[表 111]

表 111

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Me-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Et-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[表 112]

表 112

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Pr-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Pr-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 113】

【表 114】

表 113

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 114

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Me-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Et-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 115】

【表 116】

表 115

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Me-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Et-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 116

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 117】

表 117

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 118】

表 118

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Pr
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Is
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	^t Bu
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 119】

表 119

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Pr
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Is
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	^t Bu
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 120】

表 120

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
S	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₃ NMe ₂

【0035】

【表121】

表 121

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Me-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Et-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Pr-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Pr-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Bu-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Bu-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Cyclopentyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Cyclohexyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Ph-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Pyridyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Pyridyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	4-Pyridyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Furyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Furyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Thienyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Thienyl-
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CN
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CO ₂ Et
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CO ₂ H
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ OH
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ OMe
O	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₃ NMe ₂

【表122】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Me
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Pr
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Pr
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Bu
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Bu
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Cyclopentyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Cyclohexyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Ph
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Pyridyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Pyridyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	4-Pyridyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Furyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Furyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Thienyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Thienyl
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ ON
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 123】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Me
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Et
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Pr
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Pr
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Bu
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Bu
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	CF ₃
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Cyclopentyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Cyclohexyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Ph
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Pyridyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Pyridyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	4-Pyridyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Furyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Furyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Thienyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Thienyl
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ ON
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 124】

表 134

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Me-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Et-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Ph-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 125】

表 135

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Me-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Et-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁿ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 126】

表 126

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Me
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Et
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	ⁿ Bu
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	ⁱ Bu
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	CF ₃
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclopentyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclohexyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Ph
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Pyridyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Pyridyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	4-Pyridyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Furyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Furyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Thienyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Thienyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 127】

表 127

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Me
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Et
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	ⁿ Bu
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	ⁱ Bu
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	CF ₃
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclopentyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclohexyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Ph
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	4-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Furyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Furyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Thienyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Thienyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 128】

表 128

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Me
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Et
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Bu
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Bu
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	CF ₃
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclopentyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclohexyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Ph
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	4-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Furyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Furyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Thienyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Thienyl
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	CH ₃ CN
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	CH ₃ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	CH ₃ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	(CH ₃) ₂ OH
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	(CH ₃) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【0036】一般式(1)または(2)で表される化合物は、必要に応じて医療として許容される無機酸または有機酸との酸付加塩またはアルカリ付加塩とすることができる。そのような酸付加塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、および酢酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、クエン酸塩、リンゴ酸塩、酒石酸塩、アスパラギン酸塩、グルタミン酸塩等の有機カルボン酸塩、メタスルホン酸塩、ペンゼンスルホン酸塩、P-トールエンスルホン酸塩、ヒドロキシベンゼンスルホン酸塩、ジヒドロキシベンゼンスルホン酸塩等のスルホン酸塩の塩が、また、薬理学的に許容されるアルカリ付加塩としては、アンモニウム塩、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩等があげられる。本発明化合物は静脈内投与のみならず経口投与でも有効性を示すものである。前記一般式(1)または(2)で表される化合物またはその酸付加塩、アルカリ付加塩は、これを治療または予防する薬剤として用いるに当たり、非経口的または経口的に投与することが出来る。すなわち通常用いられる固形形態、例えば粉末、顆粒、錠剤、カプセル剤、シロップ剤、懸濁液等の形態で経口的に投

5-アミノ-4-シアノ-1-フェニル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] (471 mg, 2.25 mmol) のジクロロメタン (15 ml) の溶液に0℃にて攪拌下、4-トールエンホルミルシアナート (523 mg, 2.652 mmol) を滴下した。この溶液を徐々に室温まで昇温しながら7.7時間攪拌した。析出した結晶を濾取し、ジクロロメタンで洗浄し、減圧下乾燥し、4-シアノ-1-フェニル-5- (1H) -ピラゾール (820 mg, 84.1%) を合成した。融点 162-164℃

製造例2

1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール [Pol. J. Pharmaco. I. Pharm. (1974), 26 (4), 479-482より公知] の合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-1-フェニル- (1H) -ピラゾールと4-トールエンホルミルシアナートをより、反応を行い、1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 160-163℃

製造例3

3-メチル-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール [P. J. Pharmacol. Pharm. (1974), 26 (4), 479-482より公知] の合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 6155, 58, (1993) より公知] と4-トールエンホルミル

製造例4

4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールのナトリウム塩の合成
後記製造例4の方法に準じて4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールより4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 147-147℃

製造例5

4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールのナトリウム塩の合成
後記製造例4の方法に準じて4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールより4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールのナトリウム塩を合成した。融点 147-147℃

IR (KBr) 3420, 2235, 1638, 1531, 1498, 1282, 1138 cm⁻¹

【0038】製造例5

3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール [名城大学農学雑誌 28, 49-59, (1992) より公知] の合成
3-アミノ- (1H) -ピラゾール (3.830g, 46.09 mmol) のジクロロメタン (20ml) およびテトラヒドロフラン (20ml) の混合溶液に0℃にて4-トールエンホル

ミルシアナート (7.10ml, 46.443 mmol) を滴下し、0℃にて40分攪拌した。水-水浴を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら、2時間攪拌した。溶液を減圧留去し、得られた残渣をジクロロメタンより再結晶を行い、更に得られた結晶をトルエン-テトラヒドロフランの混合溶液より再結晶を行い、3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3332, 1699, 1507, 1145, 1088 cm⁻¹

製造例6

4-エトキシカルボニル-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール [名城大学農学雑誌 28, 49-59, (1992) より公知] の合成
3-アミノ-4-エトキシカルボニル- (1H) -ピラゾール (5.283g, 34.049 mmol) のジクロロメタン (20ml) およびテトラヒドロフラン (20ml) の混合溶液に0℃にて4-トールエンホルミルシアナート (5.50ml, 35.977 mmol) を滴下し、0℃にて30分攪拌した。

水-水浴を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら、2時間攪拌した。析出した結晶を濾取し、ジクロロメタンにて洗浄後、得られた結晶をジクロロメタンより再結晶を行い、4-エトキシカルボニル-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3310, 1737, 1668, 1596, 1500, 1352, 1279, 1148, 1121, 1089, 944 cm⁻¹

【0039】製造例7

4-カルボキシ-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
4-エトキシカルボニル-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール (1.615 g, 4.583 mmol) のエタノール (60ml) に室温下に、10N 水酸化カリウム水溶液を40ml加えた。60分間室温にて攪拌した後に、60℃にて1時間攪拌した。室温にて冷却した後に、塩酸を加え、中和し、析出した結晶を濾取し、水にて洗浄後、減圧下乾燥し、4-カルボキシ-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール (787mg, 53.0%) を合成した。

IR (KBr) 3271, 1720, 1599, 1510, 1352, 1280, 1155, 1090 cm⁻¹

製造例1

4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (3-ベンゼンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-フェニル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] とベンゼンホルミルシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (3-ベンゼンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール

(IH) -ピラゾールを合成した。融点 159-161℃

実施例2

4-シアノノ-1-(2-ピリジル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノノ-4-シアノノ-1-(2-ピリジル)- (IH)-ピラゾール [特開昭62-195376より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノノ-1-(2-ピリジル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールを合成した。融点 253-256℃

実施例3

4-シアノノ-1-メチル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成
製造例1の方法に準じて5-アミノノ-4-シアノノ-1-メチル- (IH)-ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノノ-1-メチル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールを合成した。融点 300℃以上

実施例4

4-シアノノ-1-シクロヘキシル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノノ-4-シアノノ-1-シクロヘキシル- (IH)-ピラゾール [Chem. Abstr. 1459, 56, (1962) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノノ-1-シクロヘキシル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールを合成した。融点 273-277℃

実施例5

4-シアノノ-1-(7-クロロキノリン-4-イル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノノ-4-シアノノ-1-(7-クロロキノリン-4-イル)- (IH)-ピラゾール [米国特許第4622300号より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノノ-1-(7-クロロキノリン-4-イル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールを合成した。融点 300℃以上

[0040] 実施例6

4-シアノノ-1-(4-ニトロフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノノ-4-シアノノ-1-

(4-ニトロフェニル)- (IH)-ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノノ-1-(4-ニトロフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールを合成した。融点 300℃以上

実施例7

4-シアノノ-1-(4-アミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

4-シアノノ-1-(4-ニトロフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾール (480mg, 1.126mmol) 及び 20% 三塩化タンブ溶液 (8.70ml, 11.281mmol) のアセトン溶液 (150ml) を室温で、4時間攪拌した。この反応溶液を水-氷に注ぎ、この溶液を飽和重炭酸水溶液を加え、pH 9とした。これを酢酸エチルで抽出し、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧留去し、残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル-メタノール 20:1) にて精製し、4-シアノノ-1-(4-アミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾール (88mg, 19.7%) を合成した。融点 275℃で分解 (ジクロロメタンより再結晶を行った。)

実施例8

4-シアノノ-1-(4-アセチルアミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

4-シアノノ-1-(4-アミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾール (8.8mg, 0.0222mmol), 塩化セチル (3μl, 0.0422mmol) 及びトリエチルアミン (20μl, 0.143mmol) のジクロロメタン (2ml) 及びテトラヒドロフラン (2ml) の混合溶液を0℃から室温まで昇温しながら、1時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し、残渣を得た。これを分取層クロマトグラフィー (酢酸エチル-メタノール 10:1) にて精製し、4-シアノノ-1-(4-アセチルアミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾール (2.8mg, 28.6%) を合成した。

IR (KBr) 3228, 2239, 1675, 1572, 1519, 1414, 1371, 1309, 1265cm⁻¹

実施例9

4-シアノノ-1-(4-メチルフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノノ-4-シアノノ-1-(4-メチルフェニル)- (IH)-ピラゾールと4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノノ-1-(1-ナフチル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールを合成した。融点 176-178℃

実施例13

4-シアノノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

8) 5-アミノノ-4-シアノノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)- (IH)-ピラゾールの合成
エトキシメチレンマロノニトリル (1.944g, 15.917mmol), 2-ヒドラジノベンゾチアゾール (2.631g, 15.924mmol) のエタノール (150ml) 溶液を、4-8時間加熱還流した。次に、加熱還流したままエタノールを約100ml留去した後冷却した。析出した結晶を濾取しエタノールで洗浄し減圧乾燥し、5-アミノノ-4-シアノノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)- (IH)-ピラゾール (3.293g, 85.7%) を合成した。融点 248-250℃

b) 4-シアノノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノノ-4-シアノノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)- (IH)-ピラゾールと4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールを合成した。融点 300℃以上

実施例14

4-シアノノ-1-ベンジル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて公知の5-アミノノ-4-シアノノ-1-ベンジル- (IH)-ピラゾール [特開昭60-115581より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノノ-1-ベンジル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールを合成した。融点 153-156℃

実施例15

4-シアノノ-1-(2-イミダゾリル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(IH)-ピラゾールの合成

a) 5-アミノノ-4-シアノノ-1-(2-イミダゾリル)- (IH)-ピラゾールの合成
エトキシメチレンマロノニトリル (4.070g, 33.325mmol), 2-ヒドラジノ-2-イミダゾリル炭化水素酸

塩 (6.030g, 33.308mmol) , ナトリウムエチラート (2.404g, 33.327mmol) のエタノール (150 ml) 溶液を2.5時間加熱還流した。冷却後、減圧留去し残渣を得た。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。この有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムにて乾燥し、通過し、減圧留去して残渣を得た。これをエタノールより再結晶を行った。更にこれをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 4 : 1) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-1- (2-イミダゾリニル) - (1H) -ピラゾール (2.050g, 5.1%) を合成した。

IR (KBr) 3363, 3208, 2233, 1647, 1556 cm^{-1}
 b) 4-シアノ-1- (2-イミダゾリニル) -5- (3- (4- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-イミダゾリニル) - (1H) -ピラゾールと4-トルエンシルホニルニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-イミダゾリニル) -5- (3- (4- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 280℃にて分解
 H) -ピラゾールを合成した。融点 167-170℃

【0042】実施例16
 4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Heterocyclic Chem., 511, 20, (1983) より公知] と4-トルエンシルホニルニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 167-170℃

実施例17
 4-シアノ-1- (2-アミノフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 1- (2-ニトロフェニル) -4-シアノ-5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾール (123mg, 0.288mmol) , 10%パラジウム炭素 (34mg) の酢酸エチル (10ml) 及びメタノール (10ml) の混合溶液を室温下、水素添加反応を2時間行った。この溶液をセライトを用い通過し、濾液を減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム-アミンモニア 10 : 90 : 1) にて精製し、4-シアノ-1- (2-アミノフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾール (113mg, 99.0%) を得た。融点 193-196℃

実施例18
 4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3-

(4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [特開平6-503069より公知] と4-トルエンシルホニルニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 156-159℃

実施例19
 4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Med. Chem., 2892, 34, (1991) より公知] と4-トルエンシルホニルニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 174-177℃

実施例20
 4-シアノ-1- (2-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-フェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 124, 0, 21, (1956) より公知] と2-トルエンシルホニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 165-168℃

【0043】実施例21
 4-シアノ-1- (2-シクロヘキシル) -5- (3- (2-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 5-アミノ-4-シアノ-1-シクロヘキシル- (1H) -ピラゾール [Chem. Abstract, 1459, 56, (1962) より公知] (210mg, 1.105mmol) のジクロロメタン (10ml) 溶液に0℃にて2-トルエンシルホニルイソシアナート (200 μ l, 1.370mmol) を加え、0℃にて20分撹拌した後、氷-水浴を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら100分撹拌した。エーテルを反応液に加え、析出した結晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 1 : 9) にて精製し、4-シアノ-1- (2-シクロヘキシル) -5- (3- (2-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾール (34mg, 8.0%) を合成した。

IR (KBr) 2935, 2233, 1720, 1615, 1278 cm^{-1}

5-アミノ-4-シアノ-1- (2-フェニル) -3-メチル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] (228mg, 1.149mmol) のジクロロメタン (10ml) に2-トルエンシルホニルイソシアナート (200 μ l, 1.370mmol) を0℃にて滴下した後、0℃にて20分撹拌し、氷-水浴を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら100分撹拌した。反応液にエーテルを加え、析出した結晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 1 : 9) にて精製し、4-シアノ-1- (2-フェニル) -3-メチル- (1H) -ピラゾール (32mg, 7.0%) を合成した。

IR (KBr) 3418, 2231, 1617, 1310, 1272 cm^{-1}
 実施例27
 4-シアノ-1- (2-エチル) -1- (2-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-エチル) -1- (2-フェニル) - (1H) -ピラゾール [Chem. Abstract, 79, 146518 より公知] と4-トルエンシルホニルニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-エチル) -1- (2-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

実施例28
 4-シアノ-1- (2-エチル) -1- (2-フェニル) -5- (3- (2-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-エチル) -1- (2-フェニル) - (1H) -ピラゾール [Chem. Abstract, 79, 146518 より公知] と2-トルエンシルホニルニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-エチル) -1- (2-フェニル) -5- (3- (2-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 159-161℃

実施例29
 3- (4-トルエンシルホニル) -4-シアノ-1- (2-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 a) 1-エチルニルイソシアナート (15.773g, 77.20mmol) 及びオルトギ酸トリエチル (15.773g, 77.20mmol) の酢酸エチル (5.100g, 77.203mmol) の無水酢酸 (100ml) 溶液を3時間加熱還流した。無水酢酸を減圧留去し、残渣を得た。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて何度も洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧留去し、残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル 3 : 1 ~ 1 : 1) にて精製し、1-エチルニルイソシアナート (10.566g, 76.8%) を得た。

IR (KBr) 3418, 2231, 1617, 1310, 1272 cm^{-1}
 実施例29
 3- (4-トルエンシルホニル) -4-シアノ-1- (2-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 a) 1-エチルニルイソシアナート (15.773g, 77.20mmol) 及びオルトギ酸トリエチル (15.773g, 77.20mmol) の酢酸エチル (5.100g, 77.203mmol) の無水酢酸 (100ml) 溶液を3時間加熱還流した。無水酢酸を減圧留去し、残渣を得た。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて何度も洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧留去し、残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル 3 : 1 ~ 1 : 1) にて精製し、1-エチルニルイソシアナート (10.566g, 76.8%) を得た。

IR (KBr) 3418, 2231, 1617, 1310, 1272 cm^{-1}
 実施例29
 3- (4-トルエンシルホニル) -4-シアノ-1- (2-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルホニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 a) 1-エチルニルイソシアナート (15.773g, 77.20mmol) 及びオルトギ酸トリエチル (15.773g, 77.20mmol) の酢酸エチル (5.100g, 77.203mmol) の無水酢酸 (100ml) 溶液を3時間加熱還流した。無水酢酸を減圧留去し、残渣を得た。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて何度も洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧留去し、残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル 3 : 1 ~ 1 : 1) にて精製し、1-エチルニルイソシアナート (10.566g, 76.8%) を得た。

週にて2時間攪拌した。更に、5.0%ジメチルアルミニウム水溶液 (600 μ l) を加え、室温にて2時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水酢酸ナトリウムにて乾燥し、減圧留去して精製を得た。これを2-メチルカルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-メタノール 97 : 3) にて精製し、4-シアノ-5-tert-ブトキシカルボニルエミノ-3-(2-ジメチルアルミニオニエチル)-1-フェニル-2-エチル-1H-ピラゾール (650mg, 76.1%) を得た。

IR (KBr) 2983, 2786, 2232, 1731, 1597, 1575, 1504, 1456, 1395, 1369, 1280, 1256, 1160, 1012, 767 cm^{-1} .

d) 5-アミノ-4-シアノ-3-(2-ジメチルアミノエチル)-1-フエニル-(H)-ピラゾールの合成。

4-シアノ-5-tert-ブトキシカルボニルアミノノール
— (2-ジメチルアミノエチル) — 1-フエニル (I)
メタンゾール (9.8%, 0.0276mol) のジクロロ
M_h (1ml) 溶液に 0°C でトリフッオロ酢酸
(1.45 μ l, 1.882mmol) を加え、徐々に室温まで昇
温しながら、9 時間攪拌した。反応溶液を減圧留去し精
造を得た。これにアノモニオ水を加え、クロロホルムに
抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸
ナトリウムにて乾燥後減圧留去し、精造を得た。これを
分取型クロマトグラフィー (シリカゲル、メタノール
— クロロホルム — アノモニオ水 10 : 90 : 1) にて精
製し、5-tert-ブトキシノール-3- (2-ジメチルア
ミノエチル) — 1-フエニル (IH) — ビラゾール
(1.8%, 25.5%) を得た。

IR (KBr) 3364, 2826, 2209, 1654, 1573, 1535, 1495, 1465, 779, 697 cm^{-1}

e) 4-シアノ-3-(2-ジメチルアミノエチル)-
1-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-(
(2-ジメチルアミノエチル)-1-フェニル-(1
H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニル
シアナチドより、反応を行い、4-シアノ-3-(2-
ジメチルアミノエチル)-1-フェニル-5-[3-
(4-クロロベンゼンスルホニル)-ウレイド]-(1
H)-ピラゾールを合成した。融点 168-170°C
実施例40

4-シアノ-1-フエニル-5-[3-(4-ニトロベンゼンスルホニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

5-アミノ-4-シアノ-1-フェニル-(H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] (960mg, 5.212mmol) のジクロロメタン (30ml) 溶液に4-ニトロベンゼンスルホニルソシアナート [T.

trahedron Letters, 2839, 34, (1993) より公知]
(1.124g, 4.926mmol) のジクロロメタン溶液 (5mL)
を0°Cにて滴下した後に、0°Cにて20分攪拌し、氷-水
浴を以て冷却し、徐々に室温まで昇温しながら100分攪拌
した。反応液を氷-水に注ぎ、クロロホルムにて抽出し
た。有機液を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウ
ムにて乾燥後、減圧留去して残渣を得た。これをシリカ
ゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホル
ム 1 : 9) にて2回精製を行い、4-シアノノ-1-
フェニル-5-[3-(4-ニトロベンゼン)スルホニ
ル]-ウレイド - (IH) -ピラゾール (62mg, 3.1
%) を合成した。

 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ : 8.37 (2H, m), 8.20 (1H, m), 8.17 (2H, m), 7.78 (2H, m), 7.53 (2H, m), 7.42 (1H, m)

【0047】実施例41
4-シアノ-1-フェニル-5-{3-(4-アミノベンゼンスルホンル)-ウレイド}-(1H)-ピラゾールの合成

4-シアノ-1-フェニル-5-[3-(4-ニトロボ
ンゼンスルホニル)-ウレイド]- (IH) -ピラゾ
ル (60.0mg, 0.145mmol) と2.0%塩化ナトリウム溶
液 (1.20ml, 1.556mmol) のアセトン (5 ml) 溶液を
7時間室温にて攪拌した。反応液を水に注ぎ飽和重
曹を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和塩
水に3回洗浄、無水硫酸ナトリウムに乾燥後、減圧留
去した。これを分取減圧クロマトグラフィー (シリカ
ゲル、メタノール-酢酸エチル 1:10) にて精製
し、4-シアノ-1-フェニル-5-[3-(4-アミ
ノベンゼンスルホニル)-ウレイド]- (IH) -ピラ
ゾール (5.6 mg, 10.1%) を合成した。

IR (KBr) 3358, 2925, 1592, 1502, 1144, 1082 cm⁻¹
实施例 42

4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5-(3-(4-トルエンスルホニル)-ウレイド)-(1H)-ピラゾールの合成

a) イソプロピルヒドロキシメチレンマロノニトリルの合成

マロニトリル (2.591 g, 0.01 mol), グラム 39.22 mmol) およ
トリエチルアミン (7.986 g, 0.06 mol) のベンゼン
(50 ml) 溶液に 0°C にて塩化イソプロパリル (4.084 g, 3
8.32 mmol) を滴下した。氷-水浴を取り除き、徐々
に室温まで昇温しながら、2 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。この有機
層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧留置で、イ
ソプロピルエーテルとドキシメチレンマロニトリル (4.894
g, 94.5%) を得た。

IR (KBr) 3202, 2983, 2242, 2228, 1560, 1464, 1253, 1095, 980 cm^{-1}

b) イソブロピルメトキシベンゾニトリルの合成

イソプロピルヒドロキシメチレンマロノニトリル (4.30 g, 31.66mmol)、硫酸ジメチル (10mL, 105.665mmol)、酸触媒のトリウム (10.375g, 97.887mmol) および水 (8mL) の 1、4-ジオキサン (75mL) 溶液を 70°C 水中にて 6 時間加熱還流した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄後、減圧留置にて精造を得た。これにベンジカグルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル 10:1) にて精製し、イソプロピルメチルシタレンマロノニトリル (1.470g, 30.7%) を得た。

IR (neat) 2990, 2225, 1570, 1470, 1335, 1215, 1105, 1000, 955 cm^{-1}

c) 5-アミノ-4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル- (IH) -ピラゾールの合成

イソプロピルメチルキシメチレンマロノニトリル (937mg, 6.230mmol) およびフェニルヒドラジン (681mg, 6.301mmol) のエタノール (20ml) 溶液を3時間加熱還流した。冷却後、エタノールを減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/酢酸エチル 10:1 → 3:1) にて精製し、5-アミノ-4-シアザ-3-イソプロピル-1-フェニル- (1H) -アジン (1.370g, 97.0%) を得た。

IR (KBr) 3364, 2826, 2209, 1654, 1573, 1535, 1495, 1465, 779, 697 cm^{-1}

d) 4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5-
-[3-(4-トルエンシルボニル)-ウレイド]-

(1H) -ピラゾールの合成

イソプロピル-1-フェニル- (IH) -ピラゾールと
4-トルエンスルホニルイソシアナートより、反応を行
い、4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5
- [3- (4-トルエンスルホニル) -ウレイド] -
(IH) -ピラゾールを合成した。融点 161-16
3°C

実施例 43
4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5-

{3- (4-クロロベンゼンスルホニル) -ウレイド}
- (IH) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルシアナートより、80℃で行い、4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-1-ピリド]-1(H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3324, 2972, 2233, 1720, 1582, 1508, 1468, 1392, 1292, 1159, 1091 cm^{-1}

【0048】実施例44
4-シアノ-3-メチル-1-フエニル-5-(3-

(4-クロロペンゼンルスホニル)-ウレイド)-(I)
H)-ピラゾールのナトリウム塩の合成
4-シアノ-3-メチル-1-フエニル-5-[3-
(4-クロロペンゼンルスホニル)-ウレイド)-(I)
H)-ピラゾール (388 mg, 0.750 mmol)
を水 (40 ml) に懸濁し、室温下で攪拌しながら 1 N
水酸化ナトリウム水溶液を 750 μ l 加え、1 時間攪拌
した。不溶物を濾取し、濾液を減圧留置し、4-シアノ
ペンゼンルスホニル-ウレイド)-(I)H)-ピラゾ
ール-3-メチル-1-フエニル-5-[3-(4-クロロ
ペンゼンルスホニル)-ウレイド)-(I)H)-ピラゾ
ールのナトリウム塩 (327 mg, 80.0%) を得
た。

IR (KBr) 3411, 2230, 1638, 1572, 1535, 1497, 139
5. 1307, 1257, 1148, 1074 cm⁻¹

実施例 45
4-シアノ-3-メチル-1-フエニル-5-(3-

(4-4トルエンスルホンル) ウレイド] - (IH) -
 ラゾールのナトリウム塩の合成
 実施例4.4の方法に準じて4-シアノ-3-メチル-1-
 -フエニル-5-[3-(4-トルエンスルホンル) -
 ウレイド] - (IH) -ピラゾールより4-シアノ-3-
 -メチル-1-フエニル-5-[3-(4-トルエンスル
 ルホンル) ウレイド] - (IH) -ピラゾールのナトリ
 ウム塩を得た。

IR (KBr) 3422, 2229, 1640, 1536, 1497, 1307, 1260, 1145, 1074 cm^{-1}

実施例 46

ルエンシルホニル) ウレイド - (H) - ピラゾール
のナトリウム塩の合成

例4.4の方法に準じて4-シアノ-1-シクロヘキシル-5-[3-(4-トルエンシルポニル)ウレイド]-(1H)-ピラゾールより4-シアノ-1-シクロヘキシル-5-[3-(4-トルエンシルポニル)ウレイド]-(1H)-ピラゾールのナトリウム塩を得た。

IR (KBr) 3399, 2931, 2856, 2236, 1629, 1575, 1455, 1275, 1144, 1099 cm^{-1}

実施例 47

4-シアノ-1-フェニル-5-(3-(4-イソプロ

ピルベンゼンスルホンル - クレイド] - (IH) - ゼ
 ラソールの合成
 5-アミノ-4-オシアノ-1-フエニル- (IH) - ゼ
 ラソール [J. Org. Chem. 1240, 21, (1956) より公
 知] (354mg, 1.92mmol) のジクロロメタン (10ml) に
 4-イソプロポルベンゼンスルホンルニルソシアナート

【ドイツ国特許1289526より公知】のクメン(2m)液を0℃にて滴下した。0℃にて20分攪拌した後、氷-水浴を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら、100分攪拌した。反応液を減圧留去し、残渣を得た。これをジメチルアセトンで抽出し、抽出液を減圧留去し、残渣を得た。

リガザルカラムクロマトグラフィー(メタノール-クロロホルム 1 : 19)にて精製した後に、さらに分取液層クロマトグラフィー(シリカゲル、メタノール-クロロホルム 1 : 9)にて精製し、4-シアノベンゼンスルホン-ウレイド - (1H) -ピラゾール (2.6 mg, 3.3 %) を合成した。

¹H-NMR (CD₃OD) δ : 7.93 (1H, s), 7.74 (2H, m), 7.41-7.49 (5H, m), 7.27 (2H, m), 2.95 (1H, Hep, J=6.9Hz), 1.26 (6H, d, J=6.9Hz)

2)

実施例 48

4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5-[3-(4-イソプロピルベンゼンスルホン)-ウレイド] - (1H) -ピラゾールの合成

実施例 47の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem. 1240, 21, (1956) より公知] と4-イソプロピルベンゼンスルホンイソシアナート [ドイツ国特許1289526 より公知] より、反応を行い、4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5-[3-(4-イソプロピルベンゼンスルホン)-ウレイド] - (1H) -ピラゾールを合成した。

¹H-NMR (CD₃OD) δ : 7.76 (2H, m), 7.41 (2H, m), 7.31 (2H, m), 2.97 (1H, Hep, J=6.9Hz), 2.35 (3H, s), 1.27 (6H, d, J=6.9Hz)

実施例 49

1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - (1H) -ピラゾールの合成

製造例 1の方法に準じて5-アミノ-1-フェニル- (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホンイソシアナートより、反応を行い、1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 176-178℃

実施例 50

3-メチル-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - (1H) -ピラゾールの合成

製造例 1の方法に準じて5-アミノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem. 6155, 58, (1993) より公知] と4-クロロベンゼンスルホンイソシアナートより、反応を行い、3-メチル-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 157-159℃

【0049】実施例 51

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-3-メチル-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールの合成

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールのナトリウム塩 (7.3 mg, 0.167mmol)、ヨードメタン (15μl, 0.241mmol) のジメチルホルムアミド (2.0ml) 溶液を室温にて4.3時間攪拌した。反応液を氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後減圧留去して残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製し、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-3-メチル-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール (34mg, 47.5%) を合成した。

IR (KBr) 3328, 2231, 1710, 1575, 1506, 1358, 1115, 7, 1086, 969, 761, 625cm⁻¹

実施例 52

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-1-ベンゼンジルウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールの合成

a) 5-ベンジルアミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールの合成
5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール (1.024g, 5.166mmol)、炭化ベンジル (0.6ml, 5.044mmol)、炭酸カリウム (2.303g, 16.663mmol) のジメチルホルムアミド (25ml) 溶液を室温にて70分攪拌した。反応液を氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄後、減圧留去し、残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル 10 : 1)にて精製し、5-ベンジルアミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール (125mg, 8.4%) を合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 7.26-7.48 (10H, m), 4.65 (2H, s), 2.31 (3H, s)

b) 製造例 1の方法に準じて5-ベンジルアミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホンイソシアナートより、反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-1-ベンゼンジルウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2232, 1592, 1504, 1380, 1321, 1251, 1133, 1086, 868, 758, 696, 640cm⁻¹

【0050】実施例 53

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールの合成
a) 4-(2-ベンゾイルヒドrazil) - 1-ベンゼンジルベリジンの合成

ベンゾイルヒドrazil (7.70g, 56.555mmol) のメタノール (50ml) 溶液に0℃にて1-ベンジル-4-ベンゾイル (10.5ml, 56.644mmol) を10分かけて滴下した。

その後、氷-水浴を取り除き、60℃にて6時間加熱攪拌した。再び0℃まで冷却し、水蒸気ほう素ナトリウム (1.97, 92.075mmol) を少しずつ加え、2時間攪拌した。メタノールを減圧留去し、残渣に水を加えジクロロメタンにて抽出した。有機層を酢酸エチルにて乾燥し、減圧留去し残渣を得た。これをエタノールより再結晶を行い、4-(2-ベンゾイルヒドrazil) - 1-ベンゼンジルベリジン (11.897g, 70.7%) を合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 7.74 (2H, m), 7.40-7.59 (4H, m), 7.22-7.32 (6H, m), 4.88 (1H, m), 3.50 (2H, s), 2.83-2.99 (3H, m), 2.04 (2H, m), 1.86 (2H, m), 1.47-1.61 (2H, m)

b) 4-ヒドrazil - 1-ベンゼンジルベリジン2塩酸塩の合成

4-(2-ベンゾイルヒドrazil) - 1-ベンゼンジルベリジン (10.107g, 33.985mmol) を濃塩酸 (23ml) と水 (13ml) の混合溶液中、4時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却した後析出した結晶を濾別した。母液を減圧留去し、残渣を得た。これにメタノールを加え更に減圧留去し、残渣を得た。これをメタノールより、再結晶を行い4-ヒドrazil - 1-ベンゼンジルベリジン2塩酸塩 (4.336g, 62.2%) を合成した。

元素分析

計算値C, 51.80; H, 7.61; N, 15.10; Cl, 25.49
実測値C, 51.73; H, 7.66; N, 15.03; Cl, 25.78
c) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールの合成

4-ヒドrazil - 1-ベンゼンジルベリジン2塩酸塩 (2.507g, 9.011mmol)、ナトリウムエチラート (1.226g, 18.016mmol)、メチルトキソメチレンマロノニトリル (1.226g, 9.010mmol) のエタノール (100ml) 溶液を4時間加熱還流した。冷却後、エタノールを減圧留去し、残渣に水を加えた後に、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄後、硫酸ナトリウム乾燥、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(メタノール-クロロホルム 3:97)にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾール (2.651g, 99.6%) を合成した。

IR (KBr) 3326, 3190, 2946, 2805, 2209, 1649, 1568, 1536cm⁻¹

d) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールの合成
製造例 1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホンイソシアナートより、反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールの合成

-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 175-177℃

【0051】実施例 54

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-1-メチル-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールの合成

a) 5-メチルアミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールの合成
5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール (1.30g, 5.196mmol) [J. Org. Chem. 1240, 21, (1956) より公知]、ヨードメタン (330μl, 5.301mmol)、炭酸カリウム (1.573g, 11.381mmol) のジメチルホルムアミド (20ml) 溶液を室温にて5.0時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウム乾燥、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム-酢酸エチル 20:1)にて精製し、5-メチルアミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール (35mg, 3.0%) を合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 7.38-7.53 (5H, m), 4.39 (1H, m), 3.15 (3H, d, J=5.3Hz), 2.31 (3H, s)

b) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-1-メチル-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールの合成

製造例 1の方法に準じて5-メチルアミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホンイソシアナートより、反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-1-メチル-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3491, 2243, 1618, 1506, 1478, 1456, 1396, 1319, 1242, 1134, 1085, 1049, 1015, 876, 841, 751, 630cm⁻¹

実施例 55

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホン)-ウレイド] - 4-シアノ-3-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールの合成

a) 4-(2-ベンゾイルヒドrazil) - 1-ベンゼンジルベリジンの合成

製造例 53の方法に準じて、4-ネトラヒドrazil (4H) - ベリジン-4-オン、ベンゾイルヒドrazil、水素化ほう素ナトリウムより、反応を行い4-(2-ベンゾイルヒドrazil) - 1-ベンゼンジルベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3298, 2939, 2853, 1637, 1548, 1479, 1319, 1095, 904cm⁻¹

b) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1- (1-ベンゼンジル) - ベリジン-4-イル) - (1H) -ピラゾールの合成

アノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニル- (1H) -ピラゾールとを反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-1-(2-ジメチルアミノエチル)-ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールを合成した。融点 93-96℃

[0054] 実施例60

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-1-(2-(4-ホルリノ)-エチル)-ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールの合成

5-[N-メトキシカルボニル-12-(4-ホルリノ)-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールの合成
製造例58a)の方法に準じて、5-(N-メトキシカルボニル)アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールと4-クロロエチル- (1H) -ピラゾールとを反応を行い、5-[N-メトキシカルボニル-12-(4-ホルリノ)-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールを合成した。

1H-NMR (CDCl₃) 7.39-7.54 (5H, m), 3.81 (1H, m), 3.66 (3H, s), 3.60 (4H, m), 3.25 (1H, m), 2.45 (3H, s), 2.35 (4H, m), 2.35-2.50 (2H, m), 2.14 (6H, s)

b) 5-[2-(4-ホルリノ)-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールの合成

製造例58b)の方法に準じて、5-(N-メトキシカルボニル)アミノ]-4-ホルリノ]-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールより、5-[2-(4-ホルリノ)-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールを合成した。

1H-NMR (CDCl₃) 7.40-7.55 (5H, m), 5.41 (1H, m), 3.52-3.59 (6H, m), 2.59 (2H, m), 2.41 (4H, m), 2.33 (3H, s)

c) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-1-[2-(4-ホルリノ)-エチル]-ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[2-(4-ホルリノ)-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニル- (1H) -ピラゾールとを反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-1-[2-(4-ホルリノ)-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールを合成した。

c) 5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(ピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾールの合成

5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾール (95mg, 0.240mmol), 10%パラジウム-炭素 (5.0mg), 塩酸アンモニウム (60.0mg, 0.951mmol) のエタノール (10ml) 溶液を時々加熱還流した。冷却後、セライトを用い遠心分離し、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール:クロロホルム 10:90) にて精製し、5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(ピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾール (73mg, 定量的) を合成した。

1H-NMR (CDCl₃) 4.32 (81H, m), 3.29-3.35 (2H, m), 2.89-2.93 (2H, m), 2.30 (3H, s), 1.93-2.26 (4H, m)

d) 5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾールの合成
5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(ピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾール (90mg, 0.295mmol), ヨードメタン (25μl, 0.402mmol), 炭酸カリウム (220mg, 1.592mmol) のジメチルホルムアミド (5.0ml) 溶液を室温にて3時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、乾燥、ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール:クロロホルム 5:95) にて精製し、5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾール (19mg, 20.2%) を合成した。

IR (KBr) 3320, 2976, 2229, 1724, 1582, 1457, 1370, 1271, 1255, 1160cm⁻¹

e) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾールの合成
5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾール (17mg, 0.0532mmol) のジクロロメタン (2.0ml) 溶液に0℃にてトリフルオロメタン:スルホン酸 (200μl) を加え、2時間攪拌した。反応液を減圧留去し、残渣を得た。これをアンモニア水を加え、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、乾燥、ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル, アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾール (290mg, 94.6%) を得た。

1H-NMR (CDCl₃) 7.21-7.35 (5H, m), 6.36 (1H, brs), 3.97 (1H, m), 3.54 (2H, s), 3.01 (2H, m), 2.33 (3H, s), 2.03-2.30 (4H, m), 1.84 (2H, m), 1.51 (9H, s)

ベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾール (5.6mg, 48.2%) を合成した。

1H-NMR (CDCl₃) 4.23 (2H, brs), 3.74 (1H, m), 2.99 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.03-2.25 (4H, m), 1.83-1.89 (2H, m)

f) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾールの合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニル- (1H) -ピラゾールとを反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピベリジン-4-イル)- (1H) -ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3468, 2236, 1686, 1637, 1258, 1210, 1114, 804, 725, 632cm⁻¹

[0056] 実施例62

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールのナトリウム塩の合成

製造例44の方法に準じて5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールより5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-3-メチル-1-フエニル- (1H) -ピラゾールのナトリウム塩を得た。

IR (KBr) 3419, 1622, 1539, 1502, 1478, 1365, 1288, 1137, 1088, 1070, 1013, 826, 755, 643, 622cm⁻¹

実施例63

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)- (1H) -ピラゾールの合成

a) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)- (1H) -ピラゾールの合成
4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシエチル)ヒドロフラン (90ml) の混合溶液中、室温にて時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、乾燥、ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール:クロロホルム 3:97) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)- (1H) -ピラゾール (947mg, 25.9%) を得た。

1H-NMR (DMSO-d₆) 6.54 (2H, brs), 4.23 (2H, t, J=

5.3Hz), 4.06 (2H, t, J=5.3Hz), 2.05 (3H, s), 1.39 (9H, s)

b) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 144-146℃

【0057】実施例64

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾール (69mg, 0.142mmol) および1N塩酸ナトリウム水溶液 (2.0ml) のエタノール (5.0ml) 溶液を室温にて3.0時間攪拌した。冷却後、1N塩酸を加え、pH 7とした後にエタノールを減圧留去した。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール/クロロホルム 10:90) にて精製し、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-(1H)-ピラゾール (32mg, 58.7%) を得た。

IR (KBr) 3401, 2925, 2853, 2231, 1736, 1618, 1572, 1478, 1260, 1146, 1088, 1014, 755, 628cm⁻¹

実施例65

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

製造例58a) 5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-ヒドロキシエチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-ヒドロキシエチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3401, 2925, 2853, 2231, 1736, 1618, 1572, 1478, 1260, 1146, 1088, 1014, 755, 628cm⁻¹

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3401, 2925, 2853, 2231, 1736, 1618, 1572, 1478, 1260, 1146, 1088, 1014, 755, 628cm⁻¹

3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例58b) 方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールより5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

【0058】実施例66

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

【0059】実施例67

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

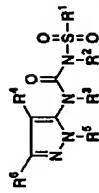
5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[N-メトキシカルボニル]-(2-メトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

ジメチルアミノエチル) - (1H) - ピラゾールの合

实施例 76

5- {3- (ベンジルスルホニル) ウレイド} -3-ス



【表131】

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
1	Ph	H	H	CN	Ph	H
2	4-Me-Ph	H	H	CN	2-pyridyl	H
3	4-Me-Ph	H	H	CN	Me	H
4	4-Me-Ph	H	H	CN	Cyclohexyl	H
5	4-Me-Ph	H	H	CN		H
6	4-Me-Ph	H	H	CN	4-NO ₂ -Ph	H
7	4-Me-Ph	H	H	CN	4-NH ₂ -Ph	H
8	4-Me-Ph	H	H	CN	4-AcNH-Ph	H
9	4-Me-Ph	H	H	CN	4-Me-Ph	H
10	4-Me-Ph	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
11	4-Me-Ph	H	H	CN	4-Br-Ph	H
12	4-Me-Ph	H	H	CN		H
13	4-Me-Ph	H	H	CN		H
14	4-Me-Ph	H	H	CN	PhCH ₂	H
15	4-Me-Ph	H	H	CN		H
16	4-Me-Ph	H	H	CN	2-NO ₂ -Ph	H
17	4-Me-Ph	H	H	CN	2-NH ₂ -Ph	H
18	4-Me-Ph	H	H	CN	2-Me-Ph	H





【表132】

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
19	4-Me-Ph	H	H	CN	2-Cl-Ph	H
20	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	H
21	2-Me-Ph	H	H	CN	Cyclohexyl	H
22	2-Me-Ph	H	H	H	Ph	H
23	4-Me-Ph	H	H	CO ₂ Et	Ph	H
24	4-Me-Ph	H	H	CO ₂ H	Ph	H
25	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Me
26	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Me
27	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Et
28	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Et
29	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	^t Bu
30	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	^t Bu
31	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Ph
32	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Ph
33	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CN
34	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CO ₂ Et

【表133】



実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
35	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CO ₂ H
36	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	H
37	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	Me
38	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	Et
39	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	Me ₂ N(CB) ₂
40	4-NO ₂ -Ph	H	H	CN	Ph	H
41	4-NH ₂ -Ph	H	H	CN	Ph	H
42	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	^t Pr
43	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	^t Pr
44	実施例化合物37のナトリウム塩					
45	実施例化合物25のナトリウム塩					
46	実施例化合物4のナトリウム塩					
47	4- ^t Pr-Ph	H	H	CN	Ph	H
48	4- ^t Pr-Ph	H	H	CN	Ph	Me
49	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	H
50	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	Me

【表134】




実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
51	4-Cl-Ph-	Me-	-H	-CN	Ph-	Me-
52	4-Cl-Ph-	-H	PhCH ₂ -	-CN	Ph-	Me-
53	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN		Me-
54	4-Cl-Ph-	-H	Me-	-CN	Ph-	Me-
55	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN		Me-
56	4-Cl-Ph-	PhCH ₂ -	-H	-CN	Ph-	Me-
57	4-Br-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
58	4-Cl-Ph-	-H	Ph-	-CN	Ph-	Me-
59	4-Cl-Ph-	-H	Me ₂ N(CH ₂) ₂ -	-CN	Ph-	Me-
60	4-Cl-Ph-	-H		-CN	Ph-	Me-
61	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN		Me-
62	実施例化合物50のナトリウム塩					
63	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	MeOCO ₂ (CH ₂) ₂ -	Me-
64	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ -OH	Me-
65	4-Cl-Ph-	-H	MeO(CH ₂) ₂ -	-CN	Ph-	Me-
66	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	CH ₂ =CH-	Me-
67	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Et-	Me-

【表135】

実施例

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
68	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	MeO(CH ₂) ₂ -	Me-
69		-H	-H	-H	Ph-	Me-
70	4-Et-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
71	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
72	4- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
73	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Me ₂ N(CH ₂) ₂ -	Me-
74	4-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Me-
75	4-MeO ₂ C-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
76	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
77	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Me-
78	4- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
79	4-HO ₂ C-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
80	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Me-
81	4-MeO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
82		-H	-H	-H	Ph-	Me-
83	4-HOCH ₂ -Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-

【表136】

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
84		-H	-H	-H	-H	Me
85		-H	-H	-H	-H	Me
86	3-Me-Ph	-H	-H	-H	-H	Me
87	4-Pr-Ph	-H	-H	-H	-H	Me
88	3-Cl-Ph	-H	-H	-H	-H	Me
89		-H	-H	-H	-H	Me
90	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	-CN	-CH ₂ CO ₂ Et
91	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	-CN	-CH ₂ CO ₂ H
92	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	-CN	-(CH ₂) ₂ OH
93	4-Pr-Ph	-H	-H	-H	-H	Me

【0068】

【発明の効果】

試験例1 5-スルホニルグリドピラゾール誘導体のECE阻害作用

方法
ラット肺ECEの阻害とECE阻害活性の測定
ラット肺組織を5mM 塩化マグネシウム、1mM フッ化フェニルメチルスルホニル (PMSF)、20μM ペプスタチンA、20μM ロイペプチンを含む20mM トリス-塩酸緩衝液 (pH7.5) 中で氷冷下ホモジナイザーでホモジナイズした。800×g で遠心し、その上清を100,000×g で超遠心し沈殿として得、上記緩衝液にて懸濁し超遠心分離する操作をさらに2度繰り返し、血漿成分などを洗浄した。その沈殿を懸濁し、ガラスホモジナイザーでホモジナイズし、超遠心分離した。最終的に得られた沈殿を0.5% Triton X-100

スルホニルグリドピラゾール誘導体のECE阻害活性

本発明化合物	IC50 (μM)
製造例1	4.6
実施例4	0.29
実施例37	0.045

試験例2 ラットにおけるbig ET-1 誘発血圧変化に対する作用

方法
雄性SD系ラット (体重230~280g) をチオバル

ピタルナトリウム (65mg/kg 体重、腹腔内投与) で麻酔下、加温した手術台に固定し、右大動脈および静脈にカテーテルを挿入して、それぞれ血圧測定および薬物投与用とした。ラットにペントリニウム (10mg/kg

を腹腔内投与し、神経節遮断した。約10分の平衡期間の後に、溶媒 (ポリエチレングリコール400) および試験化合物を静脈内投与した (0.5ml/kg)。その15分後にbig ET-1 (1nmol/kg) を静脈内投与した。big ET-1 による血圧変化を指標としたラット in vivo における試験化合物のECE阻害活性は、溶媒

投与群に対する阻害率で評価した。
結果
実施例37の化合物を投与 (3および10mg/kg) することにより、big ET-1 誘発血圧反応はそれぞれ表138のように明らかに抑制された。
【表138】

投与量 (mg/kg)	収縮期血圧の増加量 (mmHg)
0	96±4
3	65±8
10	34±6

参考例

製造例1の化合物はECE 以外のメタロプロテアーゼ、例えば、エンドペプチダーゼ、ストロメリンなどに対して阻害活性は10⁻⁵Mで20%以下であり、ECEに対して、選択性の高いものであった。

【0069】この様に本発明化合物は優れたエンドセリン変換酵素阻害作用を有し、従ってETに起因する、または起因すると考えられる各種疾患、例えば循環器系の疾患 (例えば心筋虚血、うっ血性心不全、不整脈、不安

定狭心症、心肥大、高血圧)、気管収縮 (肺性高血圧、喘息)、神経性障害 (脳血管性障害、くも膜下出血、脳卒中、脳梗塞、アルツハイマー病)、分泌系不全 (子宮頸症)、血管障害 (動脈硬化、パーリヤー病、高血圧性動脈硬化、レイノー病、糖尿病の合併症)、潰瘍 (胃潰瘍)、腫瘍 (肺がん)、腎臓障害、エンドキニンシグナル、敗血症、腎臓病 (急性および慢性腎不全) などの治療薬および予防薬として有用である。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 6	識別記号	序内整理番号	F I	技術表示箇所
A 61 K 31/415	ACD		A 61 K 31/415	ACD
	ACJ			ACJ
	ACL			ACL
	ACV			ACV
	AED			AED
31/44			31/44	
C 07 D 231/38			C 07 D 231/38	B
401/04	231		401/04	231
405/04	231		405/04	231
409/04	231		409/04	231

(72)発明者 大橋 尚仁
大阪市此花区春日中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内